

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
30. Mai 2003 (30.05.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 03/043993 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 239/46,
239/48, 239/42, 239/52, 403/12, A01N 43/54

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP02/12807

(22) Internationales Anmeldedatum:
15. November 2002 (15.11.2002)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
101 56 279.9 19. November 2001 (19.11.2001) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): BASF AKTIENGESellschaft [DE/DE];
67056 Ludwigshafen (DE).

(72) Erfinder; und

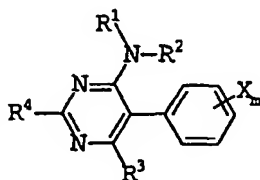
(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): GYPSER, Andreas
[DE/DE]; B 4 4, 68159 Mannheim (DE). GROTE,

Thomas [DE/DE]; Im Hoehenhausen 18, 67157
Wachenheim (DE). SCHWÖGLER, Anja [DE/DE];
Heinrich-Lanz-Strasse 3, 68165 Mannheim (DE).
RHEINHEIMER, Joachim [DE/DE]; Merziger Str.
24, 67063 Ludwigshafen (DE). SCHIEWECK, Frank
[DE/DE]; Lindenweg 4, 67258 Hessheim (DE). TORMO
I BLASCO, Jordi [ES/DE]; Mühlweg 47, 67117 Lim-
burgerhof (DE). ROSE, Ingo [DE/DE]; C 2, 19, 68159
Mannheim (DE). SCHÄFER, Peter [DE/DE]; Römerstr.
1, 67308 Ottersheim (DE). GEWEHR, Markus [DE/DE];
Goethestrasse 21, 56288 Kastellaun (DE). GRAM-
MENOS, Wassilios [GR/DE]; Samuel Hahnemann
Weg 9, 67071 Ludwigshafen (DE). MÜLLER, Bernd
[DE/DE]; Stockingerstrasse 7, 67227 Frankenthal (DE).
AMMERMANN, Eberhard [DE/DE]; Von-Gagem-Str.
2, 64646 Heppenheim (DE). STRATHMANN, Siegfried
[DE/DE]; Donnersbergstr. 9, 67117 Limburgerhof (DE).
LORENZ, Gisela [DE/DE]; Erlenweg 13, 67434 Ham-
bach (DE). STIERL, Reinhard [DE/DE]; Ginsterstr. 17,
67112 Mutterstadt (DE).

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: 5-PHENYLPYRIMIDINES, AGENTS COMPRISING THE SAME, METHOD FOR PRODUCTION AND USE
THEREOF

(54) Bezeichnung: 5-PHENYLPYRIMIDINE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG, SIE ENTHALTENDE MITTEL
UND IHRE VERWENDUNG



(I)

(57) Abstract: 5-Phenylpyrimidines of formula (I), where the substituents and the indices have the following meanings: R¹, R² = H, alkyl, haloalkyl, cycloalkyl, halocycloalkyl, alkenyl, haloalkenyl, alkynyl or haloalkynyl, where R¹ and R² together with the nitrogen atom to which they are bonded may form a saturated or unsaturated ring, interrupted by an ether, thio, sulfoxy or sulphonyl group and which can be substituted by one to four groups R^a and/or R^b, R³ = H, halo, cyano, alkyl, haloalkyl, alkoxy, haloalkoxy or alkenyloxy, R⁴ = H, halo, cyano, hydroxy, mercapto, azido, alkyl, alkenyl, alkynyl, haloalkyl, alkoxy, alkenyloxy, alkynyloxy, haloalkoxy, alkylthio,

alkenylthio, alkynylthio, haloalkylthio, -ON=CR^aR^b, -CR^c=NOR^a, -NR^cN=CR^aR^b, -NR^aR^b, -NR^cNR^aR^b, -NOR^a, -NR^cC (=NR^c) NR^aR^b, -NR^cC (=O) NR^aR^b, -NR^cC (=O) R^c, -NR^cC (=NOR^c) R^c, -OC (=O) R^c, -C (=NOR^c) NR^aR^b, -CR^c (=NNR^aR^b), -C (=O) NR^aR^b or -C (=O) R^c, where R^a, R^b, R^c are as defined in the description, X = halo, alkyl, alkoxy or haloalkyl and m = a whole number from 1 to 5. The invention further relates to methods for production of the above compounds, agents containing the same and use thereof for the treatment of noxious mycoses.

(57) Zusammenfassung: 5-Phenylpyrimidine der Formel (I), in der die Substituenten und der Index folgende Bedeutung haben: R¹, R² Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Halogenalkyl, Alkenyl, Halogenalkenyl, Alkynyl oder Halogenalkynyl, R¹ und R² können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten Ring bilden, der durch eine Ether-, Thio-, Sulfoxyloxy oder Sulfonyl-Gruppe unterbrochen sein und durch eine bis vier Gruppen R^a und/oder R^b substituiert sein kann; R³ Wasserstoff, Halogen, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy oder Alkenyloxy; R⁴ Wasserstoff, Halogen, Cyano, Hydroxy, Mercapto, Azido, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkynyloxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkenylthio, Alkynylthio, Halogenalkylthio, -ON=CR^aR^b, -CR^c=NOR^a, -NR^cN=CR^aR^b, -NR^aR^b, -NR^cNR^aR^b, -NOR^a, -NR^cC (=NR^c) NR^aR^b, -NR^cC (=O) NR^aR^b, -NR^cC (=O) R^c, -NR^cC (=NOR^c) R^c, -OC (=O) R^c, -C (=NOR^c) NR^aR^b, -CR^c (=NNR^aR^b), -C (=O) NR^aR^b oder -C (=O) R^c; worin R^a, R^b, R^c gemäss der Beschreibung definiert sind; X Halogen, Alkyl, Alkoxy oder Halogenalkyl; und m eine ganze Zahl von 1 bis 5; Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie deren Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen.

WO 03/043993 A1



(74) **Gemeinsamer Vertreter:** BASF AKTIENGESSELLSCHAFT; 67056 Ludwigshafen (DE).

(81) **Bestimmungsstaaten (national):** AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) **Bestimmungsstaaten (regional):** ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),

eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

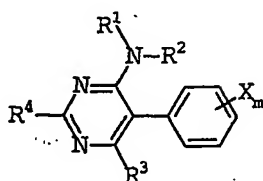
Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

Beschreibung

5-Phenylpyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung, sie enthal-
5 tende Mittel und ihre Verwendung

Die vorliegende Erfindung betrifft 5-Phenylpyrimidine der Formel
I

10



I

15 in der die Substituenten und der Index folgende Bedeutung haben:

R^1, R^2 unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl,
 C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_3 - C_6 -Halogencycloal-
kyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Halogenalkenyl, C_2 - C_6 -Alkinyl oder
20 C_2 - C_6 -Halogenalkinyl,

R^1 und R^2 können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an
das sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten
fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch eine
25 Ether-(-O-), Thio-(-S-), Sulfoxyl-(-S[=O]-) oder
Sulfonyl-(-SO₂-) Gruppe unterbrochen sein und/oder durch
eine bis vier Gruppen R^a und/oder R^b substituiert sein kann;

R^a, R^b unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_2 - C_8 -Al-
30 kenyl, C_2 - C_8 -Alkinyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy,
 C_1 - C_6 -Halogenalkoxy,

C_3 - C_{10} -Cycloalkyl, Phenyl oder fünf- bis zehngliedriger
gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer He-
35 terocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der
Gruppe O, N oder S, wobei die cyclischen Reste teilweise
oder vollständig substituiert sein können durch folgende
Gruppen R^x :

40 R^x unabhängig voneinander Cyano, Nitro, Amino, Amino-
carbonyl, Aminothiocarbonyl, Halogen, Hydroxy,
 C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Alkyl-
carbonyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfoxyl,
 C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy,
45 C_1 - C_6 -Alkyloxycarbonyl, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_6 -Alky-
lamino, Di- C_1 - C_6 -Alkylamino, C_1 - C_6 -Alkylamino-
carbonyl, Di- C_1 - C_6 -Alkylaminocarbonyl, C_1 - C_6 -Alkyl-

2

aminothiocarbonyl, Di-C₁-C₆-Alkylaminothiocarbonyl,
 C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, Phenyl, Phenoxy,
 Benzyl, Benzyloxy, 5- oder 6-gliedriges Heterocy-
 clyl, 5- oder 6-gliedriges Hetaryl,
 5- oder 6-gliedriges Hetaryloxy, C(=NOR^a)-OR^b oder
 OC(R^a)₂-C(R^b)=NOR^b,

wobei die cyclischen Gruppen ihrerseits unsubsti-
 tuiert oder substituiert sind durch einen bis drei
 Reste R^y:

R^y Cyano, Nitro, Halogen, Hydroxy, Amino, Amino-
 carbonyl, Aminothiocarbonyl, C₁-C₆-Alkyl,
 C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl,
 C₁-C₆-Alkylsulfoxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alk-
 oxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl,
 C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, Di-C₁-C₆-al-
 kylamino, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, Di-C₁-C₆-al-
 kylaminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylaminothiocarbonyl,
 Di-C₁-C₆-alkylaminothiocarbonyl, C₂-C₆-Alkenyl,
 C₂-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cyclo-
 alkenyl, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Benzyl,
 Benzyloxy, 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl,
 5- oder 6-gliedriges Hetaryl, 5- oder
 6-gliedriges Hetaryloxy oder C(=NOR^a)-OR^b;

R^a, R^b Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;

R^a und R^b können auch gemeinsam über eine Alkylen-
 oder Alkenylenkette mit dem überbrückenden Atom
 einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder
 sechsgliedrigen Ring bilden;

R³ Wasserstoff, Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogen-
 alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy oder C₃-C₈-Alkenyl-
 oxy;

R⁴ Wasserstoff, Halogen, Cyano, Hydroxy, Mercapto, Azido,
 C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkinyl, C₁-C₆-Halogenal-
 kyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₃-C₈-Alkenyloxy, C₃-C₈-Alkinyloxy,
 C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₃-C₈-Alkenylthio,
 C₃-C₈-Alkinylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, -ON=CR^aR^b,
 -CR^c=NOR^a, -NR^cN=CR^aR^b, -NR^aR^b, -NR^cNR^aR^b, -NOR^a,
 -NR^cC(=NR^c)NR^aR^b, -NR^cC(=O)NR^aR^b, -NR^aC(=O)R^c,
 -NR^aC(=NOR^c)R^c, -OC(=O)R^c, -C(=NOR^c)NR^aR^b, -CR^c(=NNR^aR^b),
 -C(=O)NR^aR^b oder -C(=O)R^c;

R^c eine der bei R^a und R^b genannten monovalenten Gruppen;

5 X Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy oder C₁-C₆-Halogenalkyl;
und

m eine ganze Zahl von 1 bis 5.

Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren zur Herstellung dieser
10 Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie deren Verwendung zur
Bekämpfung von Schadpilzen.

Pyridylpyrimidin-Derivate mit fungizider Wirkung sind bekannt aus
EP-A 407 899 DE-A 42 27 811 und WO-A 92/10490. Tetrahydropyrimi-
15 din-Derivate mit fungizider Wirkung sind aus GB-A 2 277 090 be-
kannt.

Die in den vorstehend genannten Schriften beschriebenen Verbin-
dungen sind als Pflanzenschutzmittel gegen Schadpilze geeignet.
20 Ihre Wirkung ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend.
Daher lag als Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter
Wirksamkeit zu finden.

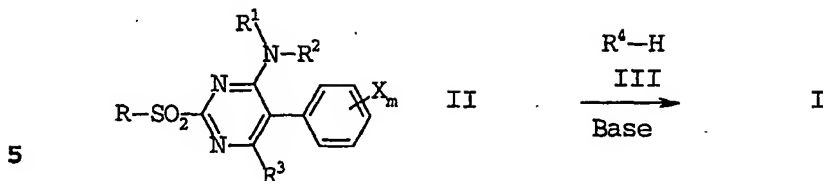
25 Demgemäß wurden die eingangs definierten Phenylpyrimidinderivate
I gefunden. Außerdem wurden Verfahren zu ihrer Herstellung sowie
sie enthaltende Mittel zur Bekämpfung von Schadpilzen und ihre
Verwendung in diesem Sinne gefunden.

30 Die Verbindungen der Formel I weisen eine gegenüber den bekannten
Verbindungen erhöhte Wirksamkeit gegen Schadpilze auf.

Die Verbindungen I können auf verschiedenen Wegen erhalten wer-
den.

35 Vorteilhaft geht man zur Herstellung der Verbindungen der Formel
I, in der R⁴ für Cyano oder eine über ein Heteroatom gebundene
Gruppe steht, von Sulfonen der Formel II aus. In Formel II haben
die Substituenten X_m und R¹ bis R³ die Bedeutung wie in Formel I
40 und R steht für C₁-C₄-Alkyl, bevorzugt für Methyl.

Die Sulfone der Formel II werden mit Verbindungen der Formel III
unter basischen Bedingungen umgesetzt. Aus praktischen Gründen
kann alternativ direkt das Alkalimetall-, Erdalkalimetall- oder
45 Ammoniumsalz der Verbindung III eingesetzt werden.



Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 25°C bis 250°C, vorzugsweise 40°C bis 210°C, in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base [vgl. DE-A 39 01 084; 10 Chimia, Bd. 50, S. 525-530 (1996); Khim. Geterotsikl. Soedin, Bd. 12, S. 1696-1697 (1998)].

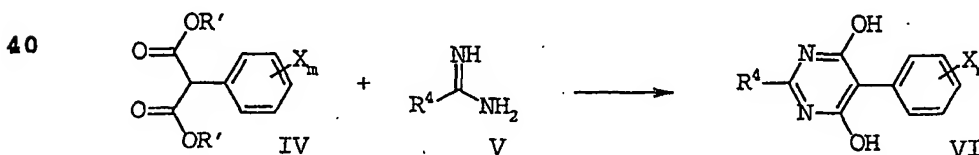
Geeignete Lösungsmittel sind halogenierte Kohlenwasserstoffe, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, 15 1,2-Dimethoxyethan, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid. Besonders bevorzugt werden Ethanol, Dichlormethan, Acetonitril und Tetrahydrofuran. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

20

Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide wie Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calciumhydroxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kalium- 25 hydrid und Calciumhydrid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate wie Lithiumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat in Betracht. Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch im Überschuß verwendet werden.

30 Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, III in bis zu 10fachem, insbesondere bis zu 3fachem Überschuß bezogen auf II einzusetzen.

35 Verbindungen der Formel I, in der R⁴ für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl oder Halogenalkyl steht, werden vorteilhaft aus Phenylmalonestern der Formel IV durch Umsetzung mit Amidinen der Formel V erhalten.



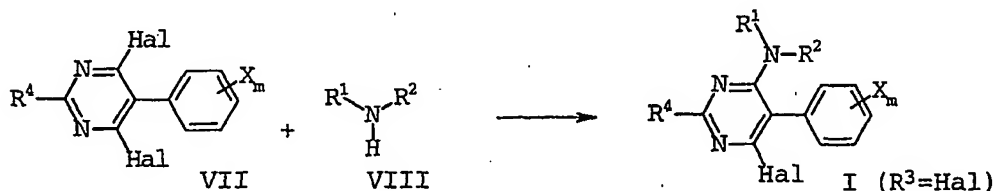
Diese Umsetzung erfolgt vorteilhaft unter den aus J. Chem. Soc. 45 (1943) S. 388 und J. Org. Chem. (1952) Bd. 17, S. 1320 bekannten Bedingungen.

Phenylmalonester der Formel IV sind aus EP-A 10 02 788 bekannt.

Hydroxypyrimidine der Formel VI werden in Halogenverbindungen VII überführt [vgl. J. Chem. Soc. (1943) S. 383; Helv. Chim. Acta 5 (1981) Bd. 64, S. 113-152]. Als Halogenierungsmittel kommen dabei insbesondere POCl_3 und POBr_3 in Betracht.

Aus Halogenpyrimidinen VII werden durch Umsetzung mit Aminen VIII Verbindungen der Formel I erhalten.

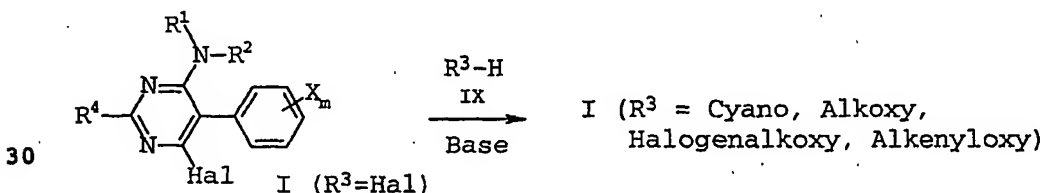
10



15

Diese Umsetzung erfolgt vorteilhaft unter den aus J. Chem. Soc. (1943) S. 383 und Chem. Eur. J. (1999) Bd. 5 (12), S. 3450-3458 bekannten Bedingungen.

20 Phenylpyrimidine der Formel I, in der R^3 für Cyano oder über Sauerstoff gebundene Gruppen steht, werden vorteilhaft aus den entsprechenden Halogenverbindungen der Formel I durch Umsetzung mit Verbindungen IX unter basischen Bedingungen erhalten. Aus praktischen Gründen kann alternativ direkt das Alkalimetall-, Erdalka-
 25 limetall- oder Ammoniumsalz der Verbindung IX eingesetzt werden.



30

Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 25°C bis 250°C, vorzugsweise 40°C bis 210°C, in einem inerten organischen Lösungsmittel ggf. in Gegenwart einer Base [vgl. Recl.

35 Trav. Chim. Pays-Bas (1942) Bd. 61, S. 291; J. Heterocycl. Chem. (1993) Bd. 30 (4), S. 993-995].

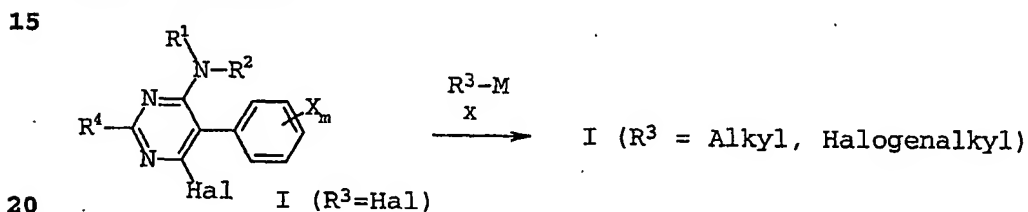
Geeignete Lösungsmittel sind Ether, Sulfoxide, Amide, besonders bevorzugt Dimethylsulfoxid, N,N-Dimethylformamid, N-Methylpyrro-
 40 lidon, N N-Dimethylacetamid, Diethylether, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkali-
 45 metall- und Erdalkalimetallhydroxide wie Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calciumhydroxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kalium-

hydrid und Calciumhydrid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate wie Lithiumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat in Betracht.

- 5 Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch im Überschuß verwendet werden.

- Phenylpyrimidine der Formel I, in der R^3 für C_1 - C_6 -Alkyl oder, C_1 - C_6 -Halogenalkyl steht, werden vorteilhaft aus den entsprechenden Halogenverbindungen der Formel I durch Umsetzung mit metallorganischen Verbindungen der Formel X, in der M für eine Gruppe Mg-Hal, Zn- R^3 oder $B(OR)_2$ steht, wobei Hal ein Halogenatom und R Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl bedeutet und R^3 für C_1 - C_6 -Alkyl steht, erhalten.



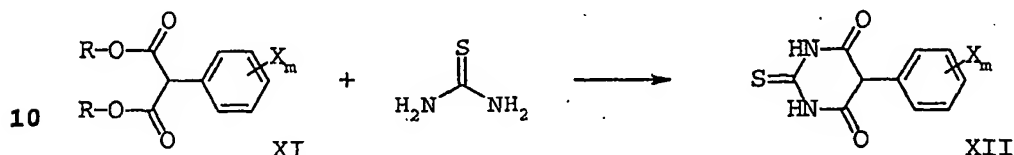
- Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von -25°C bis 250°C , vorzugsweise 0°C bis 150°C , in einem inerten organischen Lösungsmittel, ggf. in Gegenwart eines Übergangsmetallkatalysators [vgl. Chem. and Pharm. Bull. (1980) Bd. 28, Nr. 2, S. 571-577; Tetrahedron Lett. (1996) Bd. 37 (8), S. 1309; Tetrahedron Lett. (1994) Bd. 35 (19), S. 3155; Synlett (1999) Bd. 7, S. 1145].

- Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe, aromatische Kohlenwasserstoffe, Ether, besonders bevorzugt Diethylether, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, Benzol, Toluol und Xylol. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.
- 35 Als Übergangsmetall-Katalysatoren sind Eisen-, Kobalt-, Nickel-, Rhodium-, Platin- oder Palladium-Verbindungen, besonders Nickel(0)-, Nickel(II)- Palladium(0)- und Palladium(II)-Verbindungen geeignet. Dabei können Salze wie Palladiumchlorid oder Palladiumacetat oder auch Pd-Komplexe verwendet werden. Voraussetzung ist nur, daß die Liganden am Palladium unter den Reaktionsbedingungen vom Substrat verdrängt werden können.

- Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, X in bis zu 10fachem, insbesondere bis zu 3fachem Überschuß bezogen auf I einzusetzen.

Die für die Herstellung der Verbindungen I benötigten Ausgangsstoffe der Formel II können nach literaturbekannten Methoden beispielsweise auf folgender Syntheseroute erhalten werden:

- 5 Ausgehend von Phenylmalonsäurealkylestern der Formel XI und Thioharnstoff werden Verbindungen der Formel XII erhalten,



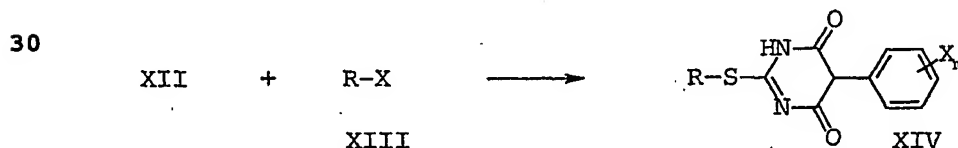
wobei in Formel XI R für C₁-C₆-Alkyl steht. Die Reaktion erfolgt üblicherweise in einem protischen Lösungsmittel wie z.B. Alkoholen, insbesondere Ethanol, gegebenenfalls in Gegenwart einer

- 15 Base, wie Na₂CO₃ und NaHCO₃. Die Reaktionstemperatur liegt vorzugsweise bei 70-220°C [vgl. Collect. Czech. Chem. Commun., Bd. 48, S. 137-143 (1983); Heteroat. Chem., Bd. 10, S. 17-23 (1999); Czech. Chem. Commun., Bd. 58, S. 2215-2221 (1993)].

- 20 Die benötigten Phenylmalonsäureester XI sind aus EP-A 10 02 788 bekannt.

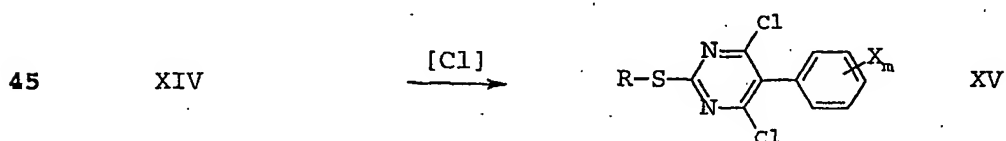
Verbindungen XII werden durch Alkylierungsmittel XIII zu Thiobarbitursäurederivaten umgesetzt. In Formel XIII bedeutet R C₁-C₆-Al-

- 25 kyl und X eine nucleophil abspaltbare Abgangsgruppe. Formel XIII steht allgemein für übliche Alkylierungsmittel, wie Methylchlorid und Methylbromid, Dimethylsulfat oder Methansulfonsäuremethylester.



- 35 Die Reaktion kann in Wasser oder auch einem dipolar aprotischen Lösungsmittel wie z.B. N,N-Dimethylformamid durchgeführt werden [vgl. US 5,250,689], sie erfolgt vorteilhaft in Gegenwart einer Base, wie beispielsweise KOH, NaOH, NaHCO₃ und Na₂CO₃ oder Pyridin. Die Reaktionstemperatur liegt vorzugsweise bei 10-60°C.

- 40 Verbindungen XIV werden in Dichlorpyrimidine der Formel XV überführt [vgl. EP-A 745 593; WO-A 99/32458; J.Org. Chem. Bd. 58, S. 3785-3786 (1993)].



Als Chlorierungsmittel [Cl] eignen sich beispielsweise POCl_3 , PCl_3/Cl_2 oder PCl_5 . Die Reaktion kann in überschüssigem Chlorierungsmittel (POCl_3) oder einem inerten Lösungsmittel durchgeführt werden. Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise zwischen 10 und 180°C.

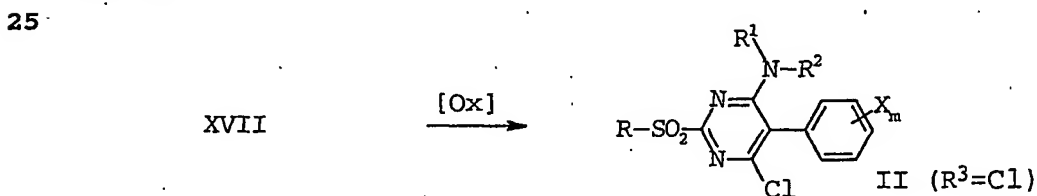
Durch Aminierung mit XVI werden die Dichlorverbindungen der Formel XV in die Verbindungen der Formel XVII überführt.



15 Diese Umsetzung erfolgt vorzugsweise bei 20 bis 120°C [vgl. J. Chem. Res. S (7), S. 286-287 (1995); Liebigs Ann. Chem., S. 1703-1705 (1995)] in einem inerten Lösungsmittel gegebenenfalls in Gegenwart einer Hilfsbase, wie NaHCO_3 , Na_2CO_3 oder tert. Amine.

20 Die Amine der Formel XVI sind käuflich oder literaturbekannt oder können nach bekannten Methoden hergestellt werden.

Die Thioverbindungen XVII werden zu den Sulfonen der Formel II oxidiert.



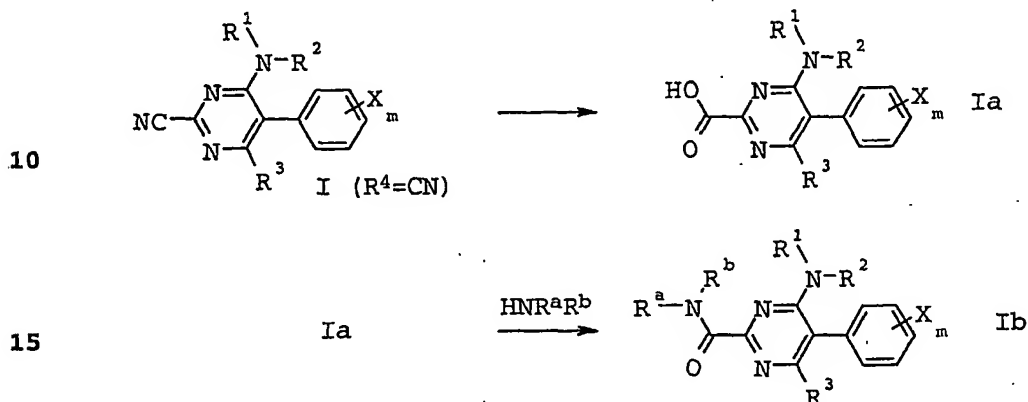
30 Die Reaktion wird vorzugsweise bei 10 bis 50°C in Gegenwart protischer oder aprotischer Lösungsmittel durchgeführt [vgl.: B. Kor. Chem. Soc., Bd. 16, S. 489-492 (1995); Z. Chem., Bd. 17, S. 63 (1977)]. Geeignete Oxidationsmittel sind beispielsweise Wasserstoffperoxid oder 3-Chlorperbenzoesäure.

Die Einführung von von Chlor verschiedenen Gruppen R^3 in die Sulfone II kann analog der Verbindungen der Formel I erfolgen.

40 Verbindungen der Formel I, in der R^4 für $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^c$, $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^b$, $-\text{C}(=\text{NOR}^c)\text{NR}^a\text{R}^b$, $-\text{C}(=\text{NNR}^a\text{R}^b)\text{R}^c$ oder $-\text{C}(=\text{NOR}^a)\text{R}^c$ steht, werden vorteilhaft aus Verbindungen der Formel I, in der R^4 Cyano bedeutet, erhalten.

45 Verbindungen der Formel I, in der R^4 für $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^b$ oder $-\text{C}(=\text{NOR}^c)\text{NR}^a\text{R}^b$ steht, sind aus den entsprechenden Nitrilen ($\text{R}^4\text{=Cyano}$) durch Verseifung zu den Carbonsäuren der Formel Ia

unter sauren oder basischen Bedingungen und Amidierung mit Aminen HNR^aR^b . Die Verseifung erfolgt üblicherweise in inerten polaren Lösungsmitteln, wie Wasser oder Alkoholen, bevorzugt mit anorganischen Basen, wie Alkali- oder Erdalkalimetallhydroxiden, insbesondere NaOH.

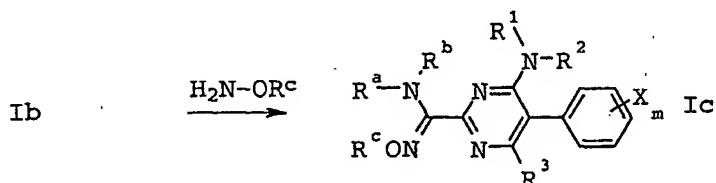


Diese Umsetzungen erfolgen vorteilhaft unter den aus Chem. and Pharm. Bull. 1982, Bd.30, N12, S.4314 bekannten Bedingungen.

20

Aus Amidon der Formel Ib werden durch Oximierung mit substituierten Hydroxyaminen $\text{H}_2\text{N-OR}^c$ unter basischen Bedingungen die Verbindungen der Formel I, in der R^4 für $-\text{C}(=\text{NOR}^c)\text{NR}^a\text{R}^b$ steht, erhalten [vgl. US 4,876,252]. Die substituierten Hydroxyamine können als freie Base oder bevorzugt in Form Ihrer Säureadditionssalze eingesetzt werden. Aus praktischen Gründen kommen dabei insbesondere die Halogenide, wie die Chloride oder die Sulfate in Frage.

30



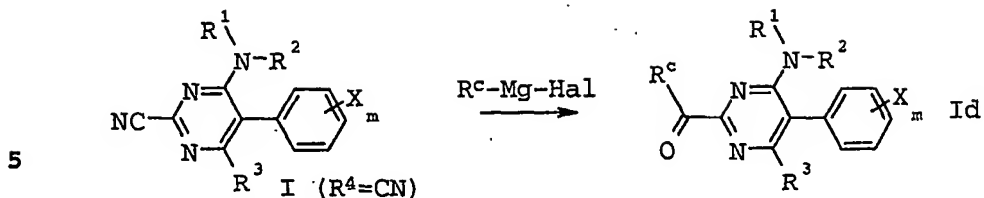
35 Alternativ können die Amidoxime der Formel Ic, in der R^a und R^b für Wasserstoff stehen, auch aus den entsprechenden Nitrilen ($\text{R}^4=\text{Cyano}$) durch Umsetzung mit Hydroxylamin und anschließender Alkylierung erhalten werden. Diese Umsetzung erfolgt vorteilhaft unter den aus DE-A 198 37 794 bekannten Bedingungen.

40

Verbindungen der Formel I, in der R^4 für $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^c$ steht, sind aus den entsprechenden Nitrilen ($\text{R}^4=\text{Cyano}$) durch Umsetzung mit Grignard-Verbindungen $\text{R}^c\text{-Mg-Hal}$, wobei Hal für ein Halogenatom, insbesondere für Chlor oder Brom steht, zugänglich.

45

10



Diese Umsetzung erfolgt vorteilhaft unter den aus J. Heterocycl. Chem. 1994, Bd.31(4), S.1041 bekannten Bedingungen.

10 Die Substituenten und Indices in Formeln Ia, Ib und Ic entsprechen denen in Formel I.

Verbindungen der Formel I, in der R^4 für $-\text{C}(=\text{NNR}^a\text{R}^b)\text{R}^c$ steht, sind über die Carbonylverbindungen Id zugänglich. Sie werden durch Um-
 15 setzung von Id mit Hydrazinen $\text{H}_2\text{NNR}^a\text{R}^b$, bevorzugt unter den aus J. Org. Chem. 1966, Bd.31, S.677 bekannten Bedingungen erhalten.

Verbindungen der Formel I, in der R^4 für $-\text{C}(=\text{NOR}^a)\text{R}^c$ steht, sind über Oximierung von Carbonylverbindungen Id zugänglich. Die Oxi-
 20 mierung von Id erfolgt analog der Oximierung der Verbindungen Ib.

Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, z.B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen-
 25 und Endprodukte fallen z.T. in Form farbloser oder schwach bräunlicher, zäher Öle an, die unter vermindertem Druck und bei mäßig erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gereinigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren
 30 oder Digerieren erfolgen.

Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend beschriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.

35

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

40 **Halogen:** Fluor, Chlor, Brom und Jod;

Alkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4 oder 6 Kohlenstoffatomen, z.B. C_1 - C_6 -Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl,
 45 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl,

2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methyl-
 5 propyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

Halogenalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch
 10 Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können, z.B. C₁-C₂-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Di-
 15 fluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl und Pentafluorethyl;

Alkoxy: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis
 20 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über ein Sauerstoffatom (-O-) an das Gerüst gebunden sind;

Alkylthio: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 10
 oder 1 bis 4 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche
 25 über ein Schwefelatom (-S-) an das Gerüst gebunden sind;

Alkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position, z.B. C₂-C₆-Alkenyl wie
 30 Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl,
 35 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl,
 40 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-bute-
 45 nyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-

12

butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl,
 5 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

Halogenalkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend genannt),
 10 wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;

15 Alkynyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position, z.B. C₂-C₆-Alkynyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl,
 20 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl,
 25 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

30

Halogenalkinyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise
 35 oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;

Alkynyloxy: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen, nicht zum Heteroatom benachbarten,
 40 Position (wie vorstehend genannt), welche über ein Sauerstoffatom (-O-) an das Gerüst gebunden sind;

13

Cycloalkyl: monocyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 6, 8 oder 10 Kohlenstoffringgliedern, z.B. C₃-C₈-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl;

5

- 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl enthaltend neben Kohlenstoffringgliedern ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isoxazolidinyl, 4-Isoxazolidinyl, 5-Isoxazolidinyl, 3-Isothiazolidinyl, 4-Isothiazolidinyl, 5-Isothiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 1,2,4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Triazolidin-3-yl, 1,3,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Triazolidin-2-yl, 2,3-Dihydrofur-2-yl, 2,3-Dihydrofur-3-yl, 2,4-Dihydrofur-2-yl, 2,4-Dihydrofur-3-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl, 2,3-Dihydrothien-3-yl, 2,4-Dihydrothien-2-yl, 2,4-Dihydrothien-3-yl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Isoxazolin-3-yl, 3-Isoxazolin-3-yl, 4-Isoxazolin-3-yl, 2-Isoxazolin-4-yl, 3-Isoxazolin-4-yl, 4-Isoxazolin-4-yl, 2-Isoxazolin-5-yl, 3-Isoxazolin-5-yl, 4-Isoxazolin-5-yl, 2-Isothiazolin-3-yl, 3-Isothiazolin-3-yl, 4-Isothiazolin-3-yl, 2-Isothiazolin-4-yl, 3-Isothiazolin-4-yl, 4-Isothiazolin-4-yl, 2-Isothiazolin-5-yl, 3-Isothiazolin-5-yl, 4-Isothiazolin-5-yl, 2,3-Dihydropyrazol-1-yl, 2,3-Dihydropyrazol-2-yl, 2,3-Dihydropyrazol-3-yl, 2,3-Dihydropyrazol-4-yl, 2,3-Dihydropyrazol-5-yl, 3,4-Dihydropyrazol-1-yl, 3,4-Dihydropyrazol-3-yl, 3,4-Dihydropyrazol-4-yl, 3,4-Dihydropyrazol-5-yl, 4,5-Dihydropyrazol-1-yl, 4,5-Dihydropyrazol-3-yl, 4,5-Dihydropyrazol-4-yl, 4,5-Dihydropyrazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 2,3-Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydrooxazol-4-yl, 2,3-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 3,4-Dihydrooxazol-5-yl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidinyl, 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl, 2-Piperazinyl, 1,3,5-Hexahydro-triazin-2-yl und 1,2,4-Hexahydro-triazin-3-yl;

45

5- oder 6-gliedriges Heteroaryl, welches neben Kohlenstoffringgliedern Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff enthalten kann: Aryl wie vorstehend genannt oder ein- oder zweikerniges Heteroaryl, z.B.

- 5 - 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isioxazolyl, 4-Isioxazolyl, 5-Isioxazolyl, 3-Isythiazolyl, 4-Isythiazolyl, 5-Isythiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl,
- 10 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl und 1,3,4-Triazol-2-yl;
- 15 - benzokondensiertes 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome oder ein Stickstoffatom und ein Sauerstoff- oder Schwefelatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, und in welchen zwei benachbarte
- 20 Kohlenstoffringglieder oder ein Stickstoff- und ein benachbartes Kohlenstoffringglied durch eine Buta-1,3-dien-1,4-diylgruppe verbrückt sein können;
- 25 - 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome: 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl;
- 30

35

Alkylen: divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 4 CH₂-Gruppen, z.B. CH₂, CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂ und CH₂CH₂CH₂CH₂;

- Oxyalkylen:** divalente unverzweigte Ketten aus 2 bis 4 CH₂-Gruppen, wobei eine Valenz über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH₂CH₂, OCH₂CH₂CH₂ und OCH₂CH₂CH₂CH₂;
- 40

- Oxyalkylenoxy:** divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 CH₂-Gruppen, wobei beide Valenzen über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH₂O, OCH₂CH₂O und OCH₂CH₂CH₂O;
- 45

15

Alkenylen: divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 CH₂-Gruppen und einer CH=CH-Gruppe in einer beliebigen Position, z.B. CH=CHCH₂, CH₂CH=CHCH₂, CH=CHCH₂CH₂, CH₂CH=CHCH₂CH₂ und CH=CHCH₂CH₂CH₂;

5

Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der Phenylpyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, besonders bevorzugt:

10

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R¹ für Wasserstoff steht.

Gleichermaßen besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R¹ und R² unabhängig voneinander C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₂-C₆-Alkenyl bedeuten.

Insbesondere werden Verbindungen der Formel I bevorzugt, in denen R¹ für C₁-C₄-Alkyl und R² für Wasserstoff steht.

20

Besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R¹ und R² gemeinsam mit dem überbrückenden Stickstoffatom einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch eine Ether- (-O-), Thio- (-S-), Sulfoxyl- (-S[=O]-) oder Sulfonylgruppe (-SO₂-) unterbrochen sein und/oder der durch eine oder zwei Methyl- oder Halogenmethylgruppen substituiert sein kann oder in dem zwei benachbarte Kohlenstoffatome durch eine Methylengruppe verbrückt sind. Die Substitution durch eine oder zwei Methyl- oder Halogenmethylgruppen, insbesondere eine oder zwei Methylgruppen ist besonders bevorzugt.

Außerdem werden Verbindungen der Formel I bevorzugt, in denen R¹ und R² gemeinsam eine Butylen-, Pentylen- oder eine Pentenylenkette bilden, die durch eine Alkyl-, insbesondere eine Methylgruppe substituiert, oder in den zwei benachbarte Kohlenstoffatome durch eine Methylengruppe verbrückt sein können.

Ferner werden Verbindungen der Formel I bevorzugt, in denen R¹ und R² gemeinsam eine Pentylen- oder eine Pentenylenkette bilden, die durch eine Methylgruppe substituiert ist.

Besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R¹ und R² gemeinsam mit dem überbrückenden Stickstoffatom eine 3- oder 4-Methylpiperidinygruppe oder eine 2-Methylpyrrolidingruppe bilden.

45

16

Daneben werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R^3 für Halogen, insbesondere für Chlor steht.

Gleichermaßen besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R^4
 5 Wasserstoff, Cyano, Azido, C_1 - C_6 -Alkyl, C_2 - C_8 -Alkenyl, C_2 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, $-ON=CR^aR^b$ oder $-NR^cN=CR^aR^b$ oder $-C(=NOR^c)NR^aR^b$ bedeutet.

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^4 für
 10 Cyano, $-CR^aNOR^b$ oder $-ON=CR^aR^b$, insbesondere für $-ON=CR^aR^b$ steht.

Daneben werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^4 für
 $-NH(=NH)NHR^c$, $-NHC(=O)NHR^a$, $-NHC(=O)R^a$, $-OC(=O)R^a$, $-C(=NOR^c)NH_2$
 oder $-CR^c(=NNR^aR^b)$ steht.

15

Weiterhin werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^4 für
 $-NR^cN=CR^aR^b$ steht.

Gleichermaßen bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R^4 für
 20 $-C(=NOR^c)NR^aR^b$, insbesondere für $-C(=NOR^c)NH_2$ steht.

Daneben werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R^4 für
 C_1 - C_6 -Alkenyl oder Azido steht.

25 Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^a und R^b
 gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl,
 C_1 - C_4 -Alkoxy, Phenyl oder einen fünf- oder sechsgliedrigen aroma-
 tischen Heterocyclus bedeuten, wobei die Ringe ggf. durch eine
 bis drei Gruppen R^x substituiert sein können; die Bedeutungen Was-
 30 serstoff, Alkyl, Alkoxy und ggf. substituiertes Phenyl sind von
 diesen besonders bevorzugt.

Besonders bevorzugte Ausgestaltungen für die Reste R^a und R^b sind
 C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_2 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_2 -alkyl, C_3 - C_6 -Al-
 35 kenyl, C_3 - C_6 -Halogenalkenyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 -Halogenalkoxy, Pyri-
 dyl, Pyrazolyl, Phenyl oder Benzyl, oder R^a und R^b bilden gemein-
 sam eine Butylen- oder Pentylenkette, wobei die cyclischen Grup-
 pen durch bis zu vier Substituenten aus Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl,
 C_1 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy und/oder C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_2 -alkyl
 40 substituiert sein können.

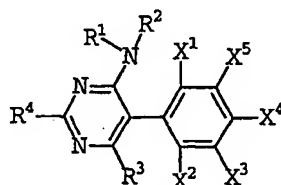
Eine bevorzugte Ausgestaltung für R^c ist Wasserstoff.

Gleichermaßen bevorzugt sind Verbindungen I, in denen X für
 45 Chlor, Fluor, Methyl, Trifluormethyl oder Methoxy steht.

17

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen ein oder zwei Substituenten X orthoständig zu der Verknüpfungsstelle mit dem Pyrimidinring stehen.

5 Daneben werden Verbindungen IA besonders bevorzugt,



IA

10

in denen R¹ bis R⁴ wie für Formel I definiert sind und X¹ bis X⁵ gleich oder verschieden sind und

- 15 X¹ Fluor, Chlor, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy; und
X², X³, X⁴, X⁵ Wasserstoff oder eine der bei X¹ und X² genannten Gruppen bedeuten.

Insbesondere werden Verbindungen IA bevorzugt, in denen

- 20 X¹, X² Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl oder Methoxy;
X³, X⁴, X⁵ Wasserstoff oder eine der bei X¹ und X² genannten Gruppen bedeuten.

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen X_m

- 25 für F₅, 2-Cl, 2-F, 2-CH₃, 2-OCH₃, 2,6-Cl₂, 2,6-F₂, 2-Cl-6-F, 2-Br-6-F, 2-CH₃-4-Cl, 2-CH₃-4-F, 2-CH₃-5-F, 2-CH₃-6-F, 2-CH₃-4-OCH₃, 2-CF₃-4-F, 2-CF₃-5-F, 2-CF₃-6-F, 2-CF₃-4-OCH₃, 2-OCH₃-6-F, 2,4,6-Cl₃, 2,3,6-F₃, 2,4,6-F₃, 2,4,6-(CH₃)₃, 2,6-F₂-4-CH₃, 2,6-F₂-4-OCH₃, 2,4-F₂-6-OCH₃, 2,6-(CH₃)₂-4-OCH₃ und
30 2,6-(CH₃)₂-4-F steht.

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen X_m für F₅, 2,6-Cl₂, 2,6-F₂, 2-Cl-6-F, 2-CH₃-4-F, 2-CH₃-6-F, 2-CH₃-4-Cl und 2,4,6-F₃ steht.

35

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der Ascomyceten, Deuteromyceten, Phycomyceten und Basidiomyceten,

- 40 aus. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen,

- 45 Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen

wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- *Alternaria*-Arten, *Podosphaera*-Arten, *Sclerotinia*-Arten, *Phylospora canker* an Gemüse und Obst,
- *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
- 10 • *Corynespora cassiicola* an Gurken,
- *Colletotrichum*-Arten an Obst und Gemüse,
- *Diplocarpon rosae* an Rosen,
- *Elsinoe fawcetti* und *Diaporthe citri* an Citrus-Früchten,
- *Sphaerotheca*-Arten an Kürbisgewächsen, Erdbeeren und Rosen,
- 15 • *Cercospora*-Arten an Erdnüssen, Zuckerrüben und Auberginen,
- *Erysiphe cichoracearum* an Kürbisgewächsen,
- *Leveillula taurica* an Paprika, Tomaten und Auberginen,
- *Mycosphaerella*-Arten an Äpfeln und japanischer Aprikose,
- *Phyllactinia kakicola*, *Gloesporium kaki*, an japanischer Aprikose,
- 20 • *Gymnosporangium yamadae*, *Leptothyrium pomi*, *Podosphaera leucotricha* und *Gloeodes pomigena* an Äpfeln,
- *Cladosporium carpophilum* an Birnen und japanischer Aprikose,
- *Phomopsis*-Arten an Birnen,
- 25 • *Phytophthora*-Arten an Citrusfrüchten, Kartoffeln, Zwiebeln, insbesondere *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
- *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
- *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- *Glomerella cingulata* an Tee,
- 30 • *Drechslera*- und *Bipolaris*-Arten an Getreide und Reis,
- *Mycosphaerella*-Arten an Bananen und Erdnüssen,
- *Plasmopara viticola* an Reben,
- *Personospora*-Arten an Zwiebeln, Spinat und Chrysantemen,
- *Phaeoisariopsis vitis* und *Sphaeloma ampelina* an Grapefruits,
- 35 • *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
- *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
- *Puccinia*-Arten und *Typhula*-Arten an Getreide und Rasen,
- *Pyricularia oryzae* an Reis,
- *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- 40 • *Stagonospora nodorum* und *Septoria tritici* an Weizen,
- *Uncinula necator* an Reben,
- *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
- *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Paecilomyces variotii* im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich, Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

5

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach der

- 10 Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

15

Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

- 20 Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 0,1 g, vorzugsweise 0,01 bis 0,05 g je Kilogramm Saatgut benötigt.

Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich

- 25 die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

- 30 Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgier-

- 40 mitteln und Dispergiermitteln, wobei im Falle von Wasser als Verdünnungsmittel auch andere organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden können. Als Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht: Lösungsmittel wie Aromaten (z.B. Xylol), chlorierte Aromaten (z.B. Chlorbenzole), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol), Ketone (z.B. Cyclohexanon), Amine (z.B. Ethanolamin, Dimethylformamid) und Wasser; Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline,

Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nicht-ionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsulfate von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate und Fettsäuren sowie deren Alkali- und Erdalkalisalze, Salze von sulfatiertem Fettalkoholglykoether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykoether, Tributylphenylpolyglykoether, Alkylarylpolyletheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoetheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, Wasser, in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Silicagel, Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produk-

te, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Beispiele für Formulierungen sind:

10

I. 5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 95 Gew.-Teilen feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 5 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

15

II. 30 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit einer Mischung aus 92 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gew.-Teilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde, innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit (Wirkstoffgehalt 23 Gew.-%).

20

III. 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 90 Gew.-Teilen Xylol, 6 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 2 Gew.-Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 2 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 9 Gew.-%).

25

30

IV. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 60 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 16 Gew.-%).

35

V. 80 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalin-alpha-sulfonsäure, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 7 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen (Wirkstoffgehalt 80 Gew.-%).

40

45

22

- VI. Man vermischt 90 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung mit 10 Gew.-Teilen N-Methyl- α -pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist (Wirkstoffgehalt 90 Gew.-%).
- 5
- VII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 20 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 10
- VIII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalin- α -sulfonsäure, 17 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Lignin-sulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 15
- 25 Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.
- 30
- 35 Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitete werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-,
- 40 Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.
- 45

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

5

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

10

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

15

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

20

25 Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

- Schwefel, Dithiocarbamate und deren Derivate, wie Ferridimethyldithiocarbamat, Zinkdimethyldithiocarbamat, Zinkethylenbisdithiocarbamat, Manganethylenbisdithiocarbamat, Mangan-Zinkethylen-diamin-bis-dithiocarbamat, Tetramethylthiuramdisulfide, Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N-ethylen-bis-dithiocarbamat), Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N'-propylen-bis-dithiocarbamat), Zink-(N,N'-propylenbis-dithiocarbamat), N,N'-Polypropylenbis-(thiocarbamoyl)disulfid;
- Nitroderivate, wie Dinitro-(1-methylheptyl)-phenylcrotonat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-3,3-dimethylacrylat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-isopropylcarbonat, 5-Nitro-isophthalsäure-di-isopropylester;
- heterocyclische Substanzen, wie 2-Heptadecyl-2-imidazolin-acetat, 2-Chlor-N-(4'-chlor-biphenyl-2-yl)-nicotinamid, 2,4-Dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin, O,O-Diethyl-phthalimidophosphonothioat, 5-Amino-1-[bis-(dimethylamino)-phosphinyl]-3-phenyl-1,2,4-triazol, 2,3-Dicyano-1,4-dithioanthrachinon, 2-Thio-1,3-dithiolo[4,5-b]chinoxalin, 1-(Butylcarbamo-yl)-2-benzimidazol-carbaminsäuremethylester, 2-Methoxycarbonyl-amino-benzimidazol, 2-(Furyl-(2))-benzimidazol, 2-(Thiazol-

30

35

40

45

- yl-(4))-benzimidazol, N-(1,1,2,2-Tetrachlorethylthio)-tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthio-tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthio-phthalimid,
- N-Dichlorfluormethylthio-N',N'-dimethyl-N-phenyl-schwefelsäure-diamid, 5-Ethoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol, 2-Rhodanmethylthiobenzthiazol, 1,4-Dichlor-2,5-dimethoxybenzol, 4-(2-Chlorphenylhydrazono)-3-methyl-5-isoxazonol, Pyridin-2-thio-1-oxid, 8-Hydroxychinolin bzw. dessen Kupfersalz, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin,
 - 10 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-dioxid, 2-Methyl-5,6-dihydro-4H-pyran-3-carbonsäure-anilid, 2-Methylfuran-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,4,5-Trimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäurecyclohexylamid, N-Cyclohexyl-N-methoxy-2,5-dimethyl-furan-3-carbonsäureamid, 2-Methyl-benzoesäure-anilid, 2-Iod-benzoesäure-anilid, N-Formyl-N-morpholin-2,2,2-trichlorethylacetal, Piperazin-1,4-diylbis-1-(2,2,2-trichlorethyl)-formamid, 1-(3,4-Dichloranilino)-1-formylamino-2,2,2-trichlorethan, 2,6-Dimethyl-N-tridecyl-morpholin bzw. dessen Salze, 2,6-Dimethyl-N-cyclododecyl-morpholin bzw. dessen Salze, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-cis-2,6-dimethyl-morpholin, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-piperidin, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-ethyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol,
 - 25 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-n-propyl-1,3-dioxolan-2-yl-methyl]-1H-1,2,4-triazol, N-(n-Propyl)-N-(2,4,6-trichlorphenoxy-ethyl)-N'-imidazol-yl-harnstoff, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanon, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanol,
 - 30 (2RS,3RS)-1-[3-(2-Chlorphenyl)-2-(4-fluorphenyl)-oxiran-2-ylmethyl]-1H-1,2,4-triazol, α -(2-Chlorphenyl)- α -(4-chlorphenyl)-5-pyrimidin-methanol, 5-Butyl-2-dimethylamino-4-hydroxy-6-methyl-pyrimidin, Bis-(p-chlorphenyl)-3-pyridinmethanol, 1,2-Bis-(3-ethoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol,
 - 35 1,2-Bis-(3-methoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol,
 - Strobilurine wie methyl (E)-2-(2-[6-(2-cyanophenoxy)pyrimidin-4-yloxy]phenyl)-3-methoxyacrylate, (E)-2-(methoxyimino)-N-methyl-2-(α -(2,5-xylyloxy)-o-tolyl]acetamide, {2-[6-(2-chlorophenoxy)-5-fluoropyrimidin-4-yloxy]phenyl} (5,6-dihydro-1,4,2-dioxazin-3-yl)methanone O-methyloxime, methyl (E)-methoxyimino[α -(o-tolyloxy)-o-tolyl]acetate, (E)-2-(methoxyimino)-N-methyl-2-(2-phenoxyphenyl)acetamide, (2E)-2-(methoxyimino)-2-(2-[(3E,5E,6E)-5-(methoxyimino)-4,6-dimethyl-2,8-dioxa-3,7-diazanona-3,6-dien-1-yl]phenyl)-N-methylacetamide, methyl-(E)-3-methoxy-2-(2-[6-(trifluoromethyl)-2-pyridyloxymethyl]phenyl)acrylate, methyl N-{2-[1-(4-chlorophe-
 - 45

25

- nyl)-1H-pyrazol-3-yloxymethyl]phenyl}(N-methoxy)carbamate, methyl (E)-methoxyimino-{(E)- α -[1-(α,α,α -trifluoro-m-tolyl)ethylideneaminoxy]-o-tolyl}acetate,
- Anilinopyrimidine wie N-(4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl)-anilin,
 - 5 N-[4-Methyl-6-(1-propinyl)-pyrimidin-2-yl]-anilin, N-[4-Methyl-6-cyclopropyl-pyrimidin-2-yl]-anilin,
 - Phenylpyrrole wie 4-(2,2-Difluor-1,3-benzodioxol-4-yl)-pyrrol-3-carbonitril,
 - Zimtsäureamide wie 3-(4-Chlorphenyl)-3-(3,4-dimethoxyphenyl)-acrylsäuremorpholid, 3-(4-Fluorphenyl)-3-(3,4-dimethoxyphenyl)-acrylsäuremorpholid,
 - 10 • sowie verschiedene Fungizide, wie Dodecylguanidinacetat, 1-(3-Brom-6-methoxy-2-methyl-phenyl)-1-(2,3,4-trimethoxy-6-methyl-phenyl)-methanon, 3-[3-(3,5-Dimethyl-2-oxycyclohexyl)-2-hydroxyethyl]-glutarimid, Hexachlorbenzol, DL-Methyl-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-N-furoyl(2)-alaninat, DL-N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-(2'-methoxyacetyl)-alanin-methylester, N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-chloracetyl-D,L-2-aminobutyrolacton, DL-N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-(phenylacetyl)-alanin-
 - 20 methylester, 5-Methyl-5-vinyl-3-(3,5-dichlorphenyl)-2,4-dioxo-1,3-oxazolidin, 3-(3,5-Dichlorphenyl)-5-methyl-5-methoxymethyl-1,3-oxazolidin-2,4-dion, 3-(3,5-Dichlorphenyl)-1-isopropylcarbamoylhydantoin, N-(3,5-Dichlorphenyl)-1,2-dimethylcyclopropan-1,2-dicarbonensäureimid, 2-Cyano-[N-(ethylaminocarbonyl)-2-methoximino]-acetamid, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-pentyl]-1H-1,2,4-triazol, 2,4-Difluor- α -(1H-1,2,4-triazolyl-1-methyl)-benzhydrylalkohol, N-(3-Chlor-2,6-dinitro-4-trifluormethyl-phenyl)-5-trifluormethyl-3-chlor-2-aminopyridin, 1-((bis-(4-Fluorphenyl)-methylsilyl)-methyl)-1H-1,2,4-triazol,
 - 30 5-Chlor-2-cyano-4-p-tolyl-imidazol-1-sulfonsäuredimethylamid, 3,5-Dichlor-N-(3-chlor-1-ethyl-1-methyl-2-oxo-propyl)-4-methylbenzamid.

Synthesebeispiele

35

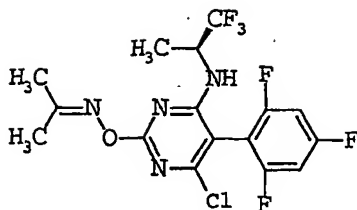
Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden Tabelle I

40 mit physikalischen Daten aufgeführt.

Beispiel 1: Herstellung von [6-Chlor-2-(N'-isopropylidene-hydrazino)-5-(2,4,6-trifluorphenyl)-pyrimidin-4-yl]-((S)-1-trifluormethyl-ethyl)-amin [I-1]

45

26

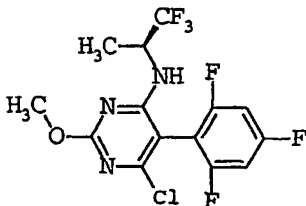


5

0,065 g (2,4 mmol) Natriumhydrid wurden in 10 ml Dimethylformamid (DMF) mit 0,16 g (2,2 mmol) Acetonoxim versetzt. Nach 1 Std. Rühren bei 20 bis 25°C wurde 1,0 g (2,2 mmol) [6-Chlor-2-methansulfonyl-5-(2,4,6-trifluor-phenyl)-pyrimidin-4-yl]-((S)-1-trifluormethyl-ethylamin (Abk. Sulfon 1) zugegeben. Nach weiteren 14 Std. Rühren bei 20 bis 25°C wurde die Mischung auf Wasser gegossen und mit Dichlormethan extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden mit Wasser gewaschen, dann getrocknet und schließlich vom Lösungsmittel befreit. Es bleiben 0,6 g der Titelverbindung vom Fp.: 157-159°C zurück.

Beispiel 2: Herstellung von [6-Chlor-2-methoxy-5-(2,4,6-trifluor-phenyl)-pyrimidin-4-yl]-((S)-1-trifluormethyl-ethyl)-amin [I-24]

20

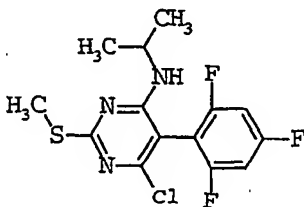


25

Eine Lösung von 282 mg (0,65 mmol) Sulfon 1 in 4 ml wasserfr. DMF wurde mit 294 mg (1,30 mmol) Natriummethylat (90%ig in Methanol) versetzt. Nach 16 Std. Rühren bei 20 bis 25°C wurde mit MTBE verdünnt, mit Wasser gewaschen, dann getrocknet. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels und Chromatographie an Kieselgel wurden 0,14 g der Titelverbindung vom Fp. 121-129°C erhalten.

Beispiel 3: Herstellung von [6-Chlor-2-methylsulfonyl-5-(2,4,6-trifluor-phenyl)-pyrimidin-4-yl]-isopropylamin [I-30]

35



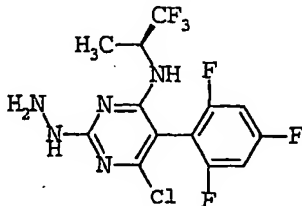
40

Eine Lösung von 216 mg (0,5 mmol) [6-Chlor-2-methansulfonyl-5-(2,4,6-trifluor-phenyl)-pyrimidin-4-yl]-isopropylamin (Abk. Sulfon 2) in 2 ml wasserfr. DMF wurde mit 70 mg (1,0 mmol) Natriumthiomethylat gelöst in 3 ml wasserfr. THF versetzt. Nach 16 Std. Rühren bei 20 bis 25°C wurde mit MTBE verdünnt, mit Wasser gewaschen, dann getrocknet. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels

tels und Chromatographie an Kieselgel wurden 0,21 g der Titelverbindung vom Fp. 112-116°C erhalten.

Beispiel 4: Herstellung von [6-Chlor-2-hydrazino-5-(2,4,6-trifluorphenyl)-pyrimidin-4-yl]-((S)-1-trifluoromethyl-ethyl)-amin

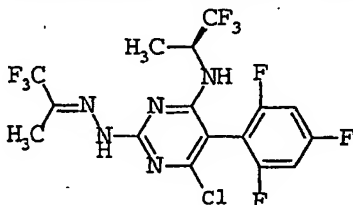
10



Eine ethanolische Lösung von 0,5 g (1,15 mmol) Sulfon 1 und 0,13 g (2,54 mmol) Hydrazinhydrat wurde 2 Std. bei 20 bis 25°C gerührt. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels und Auskochen des Rückstandes in Diisopropylether wurde der Rückstand abfiltriert und mit Diisopropylether/Hexan 1:1 nachgewaschen.

Beispiel 5: Herstellung von [6-Chloro-2-[N'-(1-trifluormethyl-ethylidene)-hydrazino]-5-(2,4,6-trifluorphenyl)-pyrimidin-4-yl]-((S)-1-trifluoromethyl-ethyl)-amin [I-56]

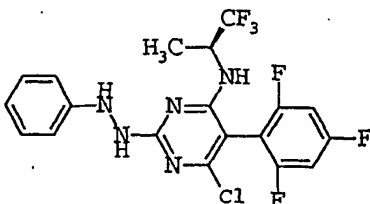
25



Eine Lösung von 0,8 g (2,07 mmol) des Hydrazids aus Bsp. 4 und 0,28 g (2,49 mmol) 1,1,1-Trifluoraceton in Acetonitril wurde 16 Std. bei 20 bis 25°C gerührt. Der Niederschlag wurde abfiltriert; aus dem Filtrat erhielt man nach Chromatographie an Kieselgel (CH:MTBE 95:5) 0,3 g der Titelverbindung vom Fp. 205-207 °C.

Beispiel 6: Herstellung von [6-Chlor-2-(N-phenyl-hydrazino)-5-(2,4,6-trifluorphenyl)-pyrimidin-4-yl]-((S)-1-trifluormethyl-ethyl)-amin [I-62]

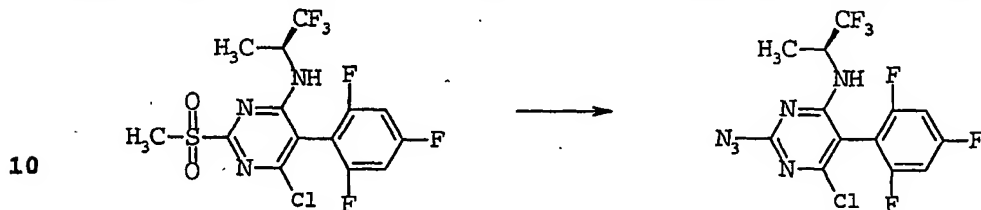
40



Eine ethanolische Lösung von 0,5 g (1,15 mmol) Sulfon 1 und 0,15 g (1,38 mmol) Phenylhydrazin wurde 14 Std. refluxiert. Nach Abkühlen und Abdestillieren des Lösungsmittels und Chromatogra-

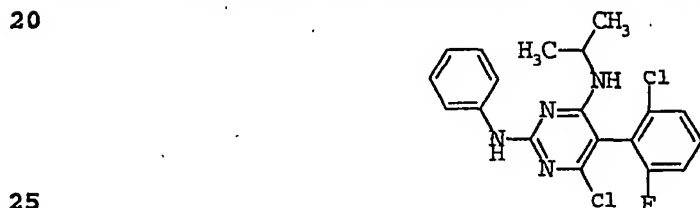
phie an Kieselgel (Cyclohexan:Methyl-tert.butylether [MTBE] 95:5) wurden 0,36 g der Titelverbindung erhalten.

Beispiel 7: Herstellung von [2-Azido-6-chlor-5-(2,4,6-trifluor-phenyl)-pyrimidin-4-yl]-((S)-1-trifluoromethyl-ethyl)-amin [I-66]



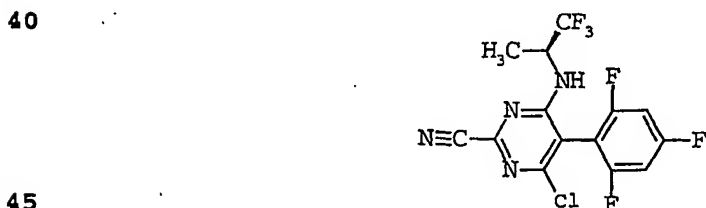
Eine Lösung von 0,5 g (1,15 mmol) Sulfon 1 und 0,11 g (1,62 mmol) Natriumazid in Acetonitril wurde 2 Std. refluxiert. Nach Abkühlen und Abdestillieren des Lösungsmittels und Digerieren des Rückstandes in Wasser wurden 0,33 g der Titelverbindung vom Fp. 152-154°C erhalten.

Beispiel 8: Herstellung von 6-Chloro-5-(2-chloro-6-fluor-phenyl)-N¹-isopropyl-N²-phenylpyrimidin-2,4-diamin [I-69]



Eine Suspension von 2,9 g Butyllithium (15%ige Lösung in Hexan) in 15 ml Tetrahydrofuran [THF] wurde bei -70°C mit 0,62 g (6,6 mmol) Anilin versetzt, dann 1 Stunde bei -70°C nachgerührt. Nach Zusatz von 1,0 g (2,64 mmol) [6-Chlor-5-(2-chlor-6-fluor-phenyl)-2-methansulfonyl-pyrimidin-4-yl]-isopropyl-amin (Abk. Sulfon 3) wurde auf 20 bis 25°C erwärmt. Die Reaktionsmischung wurde in Eiswasser gegossen und mit Salzsäure angesäuert. Es wurde mit 2 x 40 ml MTBE extrahiert, aus den vereinigten organischen Phasen wurde nach Trocknen und Abdestillieren des Lösungsmittels 1,0 g der Titelverbindung erhalten.

Beispiel 9: Herstellung von 4-Chlor-6-((S)-1-trifluormethyl-ethylamino)-5-(2,4,6-trifluorphenyl)-pyrimidin-2-carbonitril [I-73]

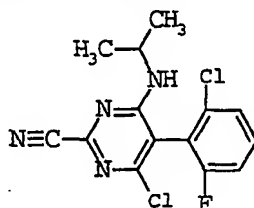


29

Eine Lösung von 0,5 g (1,15 mmol) Sulfon 1 und 0,36 g (2,31 mmol) Tetraethylammoniumcyanid in Dichlormethan wurde 20 Std. bei 20 bis 25°C gerührt. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels und Chromatographie an Kieselgel (Cyclohexan [CH]:MTBE 9:1) wurden 0,18 g 5 der Titelverbindung vom Fp. 134-136°C erhalten.

Beispiel 10: Herstellung von 4-Chlor-5-(2-chlor-6-fluorphenyl)-6-isopropylamino-pyrimidin-2-carbonitril [I-74]

10



15 Eine Lösung von 1,0 g (2,63 mmol) Sulfon 3 und 0,21 g (3,16 mmol) Kaliumcyanid in Acetonitril wurde 5 Tage bei 20 bis 25°C gerührt. Das Lösungsmittel wurde abdestilliert und der Rückstand in MTBE:Essigsäureethylester [EE] 9:1 digeriert. Nach Abfiltrieren und Einengen des Filtrats wurden 0,61 g der Titelver-

20 bindung vom Fp. 186-188°C erhalten.

25

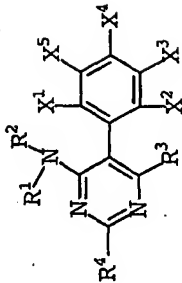
30

35

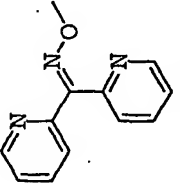
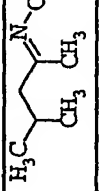
40


45

Tabelle I


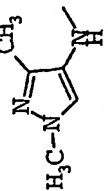



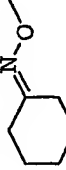
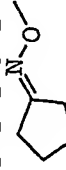
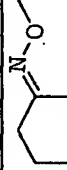
Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	phys. Daten (Fp. [°C])
I-1	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-O-N=C(CH ₃) ₂	F	F	H	F	H	157-159
I-2	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl		F	F	H	F	H	88-92
I-3	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl		F	F	H	F	H	176-179
I-4	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-O-N=C(CH ₃)C ₆ H ₅	F	F	H	F	H	151-155
I-5	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-ON=C(CH ₃)-OCH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	110-112
I-6	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-O-N=CHC ₆ H ₅	F	F	H	F	H	145-146
I-7	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-O-N=CHCH ₃	F	F	H	F	H	139-141
I-8	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl		F	F	H	F	H	350

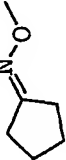
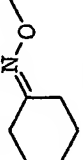
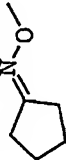
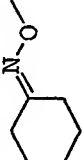
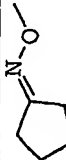
Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	phys. Daten (Fp. [°C])
I-9	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl		F	F	H	F	H	84-86
I-10	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl		F	F	H	F	H	68-70
I-11	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-O-N=CH(2,6-Cl ₂ -C ₆ H ₃)	F	F	H	F	H	87-90
I-12	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-O-CH ₃	F	F	H	F	H	137-139
I-13	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-O-CH ₃	Cl	F	H	H	H	147-149
I-14	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-O-CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-15	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-O-CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	H	H	165-168
I-16	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-O-CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-17	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-O-CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	H	H	110-112
I-18	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-O-CH(CH ₃) ₂	Cl	F	H	H	H	125-127
I-19	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-O-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	116-117
I-20	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-O-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	H	H	98-100
I-21	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-O-C(CH ₃) ₃	Cl	F	H	H	H	118-121
I-22	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-O-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	H	H	108-111
I-23	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-O-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	129-131
I-24	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-O-CH ₃	F	F	H	F	H	121-129

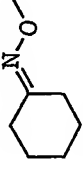
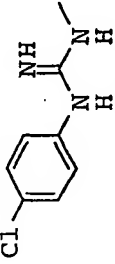
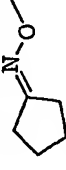
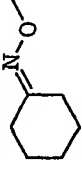
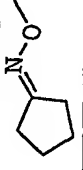
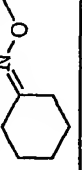
Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	phys. Daten (Fp. [°C])
I-25	(S) -CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-O-CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	147-149
I-26	(S) -CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-O-CH(CH ₃) ₂	F	F	H	F	H	159-161
I-27	-CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		Cl	-HO	Cl	F	H	H	H	164-169
I-28	-CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		Cl	-O-CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-29	-CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-30	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-CH ₃	F	F	H	F	H	112-116
I-31	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-CH ₃	Cl	F	H	H	H	106-110
I-32	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-33	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	H	H	104-108
I-34	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	95-98
I-35	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	H	H	Öl
I-36	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-CH(CH ₃) ₂	F	F	H	F	H	Öl
I-37	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-CH(CH ₃) ₂	Cl	F	H	H	H	111-113
I-38	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	H	H	Öl
I-39	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-C(CH ₃) ₃	Cl	F	H	H	H	94-96
I-40	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-41	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	H	H	114-117
I-42	(S) -CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-S-CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-43	(S) -CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-S-CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	68-69

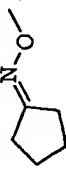
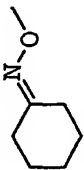
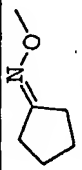
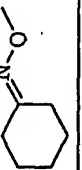
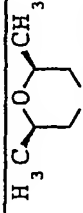
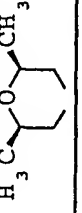
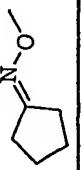
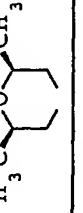
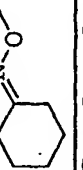
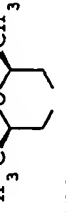
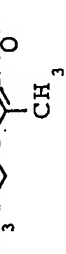
Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	phys. Daten (Fp. [°C])
I-44	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-S-CH(CH ₃) ₂	F	F	H	F	H	73-76
I-45	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-S-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-46	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-S-C(CH ₃) ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-47	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	64-65
I-48	CH ₂ CH=CH ₂	H	Cl	-S-CH ₃	F	H	H	H	H	124-126
I-49	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Cl	-S-CH ₃	F	H	H	H	H	Öl
I-50	-CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -	CH ₂ CH ₂ -	Cl	-S-CH ₃	F	H	H	H	H	Öl
I-51	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-CH ₃	F	H	H	H	H	Öl
I-52	-CH ₂ SCH ₂ CH ₂ -		Cl	-S-CH ₃	F	H	H	H	H	Öl
I-53	CH ₂ -Ph	H	Cl	-S-CH ₃	F	H	H	H	H	135-137
I-54	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-N(CH ₃)-N=C(CF ₃)CH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-55	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-N(CH ₃)-N=C(CH ₃)-C ₆ H ₅	F	F	H	F	H	Öl
I-56	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-NH-N=C(CF ₃)CH ₃	F	F	H	F	H	205-207
I-57	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-NH-N=C(CH ₃)-C ₆ H ₅	F	F	H	F	H	185-187
I-58	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-NH-N=C(CF ₃)-C ₆ H ₅	F	F	H	F	H	84-87
I-59	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-NH-N=CH-C ₆ H ₅	F	F	H	F	H	138-140
I-60	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-N(CH ₃)-N=C(CH ₃) ₂	F	F	H	F	H	205-208
I-61	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-N(CH ₃)-N=CH-C ₆ H ₅	F	F	H	F	H	152-155
I-62	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-NH-NH-C ₆ H ₅	F	F	H	F	H	Öl

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	phys. Daten (Fp. [°C])
I-63	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl		F	F	H	F	H	132-134
I-64	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-N(CH ₃)-NH ₂	F	F	H	F	H	126-128
I-65	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-NH-NH-CH ₂ CF ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-66	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-N ₃	F	F	H	F	H	152-154
I-67	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-N(CH ₃) ₂	Cl	F	H	H	H	91-94
I-68	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-NH-OCH ₃	Cl	F	H	H	H	151-153
I-69	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-NH-C ₆ H ₅	Cl	F	H	H	H	Öl
I-70	CH(CH ₃) ₂	H	Cl		Cl	F	H	H	H	Öl
I-71	-CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		Cl	-NHCH(CH ₃) ₂	Cl	F	H	H	H	107-109
I-72	-CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		Cl	-N(CH ₂ CH ₃) ₂	Cl	F	H	H	H	Öl
I-73	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-CN	F	F	H	F	H	134-136
I-74	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-CN	Cl	F	H	H	H	186-188
I-75	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-CH ₃	F	F	H	F	H	83-85
I-76	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-CH ₃	Cl	F	H	H	H	87-90
I-77	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	Cl	-CH ₃	H	H	F	H	H	75-77
I-78	-CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		Cl	-CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	H	H	Öl
I-79	-CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		Cl	-CH ₂ CH=CH ₂	Cl	F	H	H	H	Öl


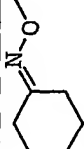
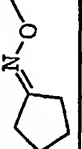
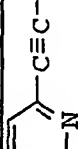
Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	phys. Daten (Fp. [°C])
I-80	-CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -		Cl	-CH(CH ₃) ₂	Cl	F	H	H	H	Öl
I-81	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-S-CH ₃	F	F	H	F	H	94-96
I-82	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Cl	-O-N=C(CH ₃) ₂	F	F	H	F	H	91
I-83	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Cl		F	F	H	F	H	180
I-84	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Cl		F	F	H	F	H	157
I-85	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Cl	-O-N=CH(2,6-Cl ₂ -C ₆ H ₃)	F	F	H	F	H	159
I-86	C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Cl	-CN	F	F	H	F	H	113-118
I-87	(R)-C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	Cl	-CF ₃	F	F	H	OCH ₃	H	Öl
I-88	-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		Cl	-O-N=C(CH ₃) ₂	F	F	H	F	H	Öl
I-89	-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-90	-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-91	-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		Cl	-NH-C(=NH)CH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-92	-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		Cl	-NH-C(=NH)CH ₃	Cl	F	H	H	H	Öl
I-93	-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)-		Cl	-NH-C(=NH)CH ₃	F	H	H	CH ₃	H	Öl
I-94	-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		Cl	-NH-C(=NH)CH ₃	CH ₃	H	H	CH ₃	H	Öl
I-95	(R)-C(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-CN	F	F	H	F	H	99-105

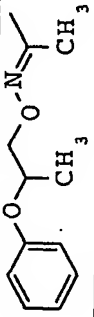
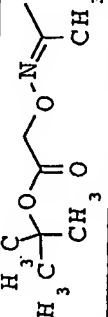
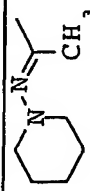
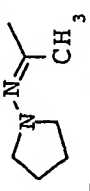
Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	phys. Daten (Fp. [°C])
I-96	(R) -C(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-O-N=C(CH ₃) ₂	F	F	H	F	H	120-123
I-97	(R) -C(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl		F	F	H	F	H	106-109
I-98	(R) -C(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl		F	F	H	F	H	120-123
I-99	(R) -C(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-OH	F	F	H	F	H	84-101
I-100	(R) -C(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-CN	F	F	H	F	H	156-158
I-101	(S) -C(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-NH-C(=NH)CH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-102	(R) -C(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-O-N=C(CH ₃) ₂	Cl	F	H	H	H	Öl
I-103	(R) -C(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl		Cl	F	H	H	H	Öl
I-104	(R) -C(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl		Cl	F	H	H	H	Öl
I-105	(R) -C(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-ON=C(CH ₃) -OCH ₂ CH ₃	Cl	F	H	H	H	Öl
I-106	(R) -C(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-ON=CH-C ₆ H ₅	Cl	F	H	H	H	Öl
I-107	(R) -C(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-O-N=CH(2,6-Cl ₂ -C ₆ H ₃)	Cl	H	H	F	H	127
I-108	(R) -C(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-CF ₃	F	F	H	OCH ₃	H	Öl
I-109	-(CH ₂) ₅ -		Cl	-O-N=C(CH ₃) ₂	F	F	H	F	H	98-102
I-110	-(CH ₂) ₅ -		Cl		F	F	H	F	H	Öl

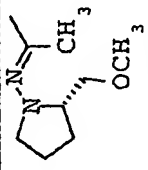
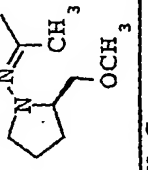
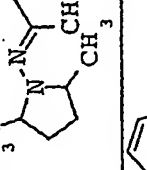
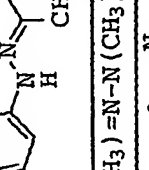
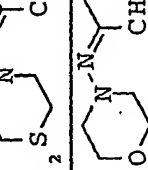
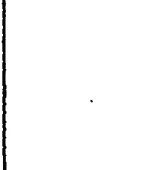
Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	phys. Daten (Fp. [°C])
I-111	-(CH ₂) ₅ -		Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-112	-(CH ₂) ₅ -		Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-113	-(CH ₂) ₅ -		Cl	-NH-C(=O)CH ₃	F	F	H	F	H	123-125
I-114	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	Cl	-ON=C(CH ₃) ₂	F	F	H	F	H	133
I-115	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	Cl		F	F	H	F	H	155
I-116	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	Cl		F	F	H	F	H	146
I-117	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	H	Cl	-CN	F	F	H	F	H	126-129
I-118	-(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)CH ₂ -		Cl	-O-N=C(CH ₃) ₂	F	F	H	F	H	Öl
I-119	-(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)CH ₂ -		Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-120	-(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)CH ₂ -		Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-121	-(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)CH ₂ -		Cl	-CN	F	F	H	F	H	107-109
I-122	-(CH ₂) ₃ CH(CH ₃)CH ₂ -		Cl	-CH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-123	-(CH ₂) ₂ SO ₂ (CH ₂) ₂ -		Cl	-O-N=C(CH ₃) ₂	F	F	H	F	H	141-149

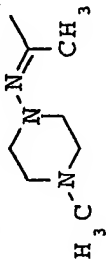
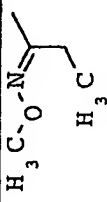


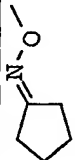
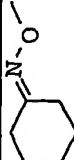
Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	phys. Daten (Fp. [°C])
I-124	$-(\text{CH}_2)_2\text{SO}_2(\text{CH}_2)_2-$		Cl		F	F	H	F	H	179-188
I-125	$-(\text{CH}_2)_2\text{SO}_2(\text{CH}_2)_2-$		Cl		F	F	H	F	H	181-191
I-126	$-(\text{CH}_2)_2\text{SO}_2(\text{CH}_2)_2-$		Cl	$-\text{NH}-\text{C}(=\text{NH})\text{CH}_3$	F	F	H	F	H	Öl
I-127	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CHCH}_2-$		Cl	$-\text{ON}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$	F	F	H	F	H	Öl
I-128	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CHCH}_2-$		Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-129	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CHCH}_2-$		Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-130	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}=\text{CHCH}_2-$		Cl	CN	F	F	H	F	H	89-98
I-131			Cl	$-\text{ON}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$	F	F	H	F	H	82-90
I-132			Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-133			Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-134			Cl		F	F	H	F	H	Öl


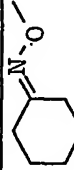
Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	phys. Daten (Fp. [°C])
I-135			Cl		F	F	H	F	H	96
I-136			Cl		F	F	H	F	H	72
I-137			Cl	-ON=CH-C ₆ H ₅	F	F	H	F	H	125
I-138			Cl	-ON=C(CH ₃)-C ₆ H ₅	F	F	H	F	H	119
I-139			Cl	-O-N=CH(2,6-Cl ₂ -C ₆ H ₃)	F	F	H	F	H	154
I-140	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-O-N=C(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	H	H	H	Öl
I-141	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-O-N=C(CH ₃) ₂	F	F	H	F	H	98-102
I-142	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		CH ₃	-O-N=C(CH ₃) ₂	F	F	H	F	H	Öl
I-143	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-144	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-145	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl		F	F	H	F	H	Öl

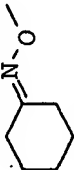
Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	phys. Daten (Fp. [°C])
I-146	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-ON=C(CH ₃)-OCH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	70
I-147	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-ON=CH-C ₆ H ₅	F	F	H	F	H	Öl
I-148	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-ON=C(CH ₃)-C ₆ H ₅	F	F	H	F	H	96
I-149	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-O-N=CH(2,6-Cl ₂ -C ₆ H ₃)	F	H	H	F	H	128
I-150	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		OCH ₃	-ON=C(CH ₃)-OCH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-151	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		OCH ₃		CH ₃	H	H	F	H	105
I-152	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		OCH ₃		F	F	H	F	H	Öl
I-153	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		OCH ₃		F	F	H	F	H	Öl
I-154	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		OCH ₃	-ON=CH-C ₆ H ₅	F	F	H	F	H	Öl
I-155	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		OCH ₃	-O-N=CH(2,6-Cl ₂ -C ₆ H ₃)	F	H	H	F	H	Öl
I-156	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-OH	F	F	H	F	H	239-242
I-157	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-CH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-158	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-159	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		OCH ₃	-CN	F	F	H	F	H	106-124
I-160	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-CN	F	F	H	F	H	Öl
I-161	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl		F	F	H	F	H	Öl

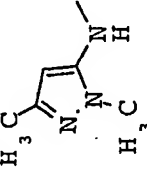
Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	phys. Daten (Fp. [°C])
I-162	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-C(CH ₃)=N-OCH ₃	F	F	H	F	H	117
I-163	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-C(CH ₃)=N-OCH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-164	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-C(CH ₃)=N-O(CH ₂) ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-165	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-C(CH ₃)=N-OCH(CH ₃) ₂	F	F	H	F	H	Öl
I-166	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-C(CH ₃)=N-O(CH ₂) ₃ CH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-167	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-C(CH ₃)=N-OC(CH ₃) ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-168	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-C(CH ₃)=N-OCH ₂ CH=CHCl	F	F	H	F	H	Öl
I-169	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-C(CH ₃)=N-OCH ₂ CH=CH ₂	F	F	H	F	H	Öl
I-170	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-C(CH ₃)=N-OCH ₂ CCl=CH ₂	F	F	H	F	H	Öl
I-171	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-C(CH ₃)=N-O(CH ₂) ₂ OCH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-172	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-173	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-174	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-C(CH ₃)=N-NH-C(CH ₃) ₂	F	F	H	F	H	Öl
I-175	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-176	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl		F	F	H	F	H	Öl


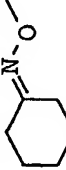
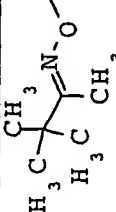
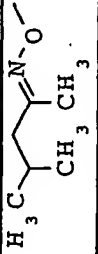
Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	phys. Daten (Fp. [°C])
I-177	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-178	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-179	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-180	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-181	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-C(CH ₃)=N-N(CH ₃)-C ₆ H ₅	F	F	H	F	H	Öl
I-182	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-183	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl		F	F	H	F	H	Öl

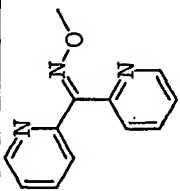
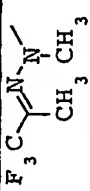
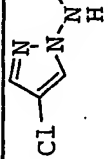
Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	phys. Daten (Fp. [°C])
I-184	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-185	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-C(NH ₂)=N-OH	F	F	H	F	H	Öl
I-186	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-C(NH ₂)=N-OCH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-187	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-188	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-CN	CH ₃	CH ₃	H	H	H	Öl
I-189	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-O-N=C(CH ₃) ₂	F	F	H	OCH ₃	H	Öl
I-190	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl		F	F	H	OCH ₃	H	Öl
I-191	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl		F	F	H	OCH ₃	H	Öl
I-192	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-CN	F	F	H	OCH ₃	H	Öl
I-193	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-CF ₃	F	F	H	OCH ₃	H	Öl
I-194	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-O-N=C(CH ₃) ₂	Cl	F	H	H	H	109
I-195	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl		Cl	F	H	H	H	Öl
I-196	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl		Cl	F	H	H	H	Öl

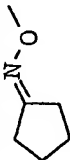
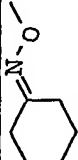
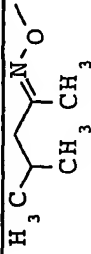
Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	phys. Daten (Fp. [°C])
I-197	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	(CH ₂) ₂ -	Cl	-O-N=CH(2,6-Cl ₂ -C ₆ H ₃)	Cl	F	H	H	H	126
I-198	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	(CH ₂) ₂ -	Cl	-OH	Cl	F	H	H	H	164-169
I-199	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	(CH ₂) ₂ -	Cl	-O-CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	H	H	Öl
I-200	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	(CH ₂) ₂ -	Cl	-O-CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH=CH ₂	Cl	F	H	H	H	Öl
I-201	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	(CH ₂) ₂ -	Cl	-NHCH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	Cl	F	H	H	H	107-109
I-202	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	(CH ₂) ₂ -	Cl	-N(CH ₃ CH ₂) ₂	Cl	F	H	H	H	Öl
I-203	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	(CH ₂) ₂ -	Cl	-CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	H	H	Öl
I-204	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	(CH ₂) ₂ -	Cl	-CH(CH ₃) ₂	Cl	F	H	H	H	Öl
I-205	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	(CH ₂) ₂ -	Cl	-CH ₂ CH=CH ₂	Cl	F	H	H	H	Öl
I-206	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	(CH ₂) ₂ -	Cl	-CN	Cl	F	H	H	H	Öl
I-207	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	(CH ₂) ₂ -	Cl	-S-CH ₃	F	H	H	H	H	Öl
I-208	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	(CH ₂) ₂ -	Cl	-O-N=C(CH ₃) ₂	F	H	H	CH ₃	H	Öl
I-209	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	(CH ₂) ₂ -	Cl		F	H	H	CH ₃	H	136
I-210	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	(CH ₂) ₂ -	Cl		F	H	H	CH ₃	H	Öl
I-211	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	(CH ₂) ₂ -	Cl	-CN	F	H	H	CH ₃	H	95-97
I-212	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	(CH ₂) ₂ -	OCH ₃	-O-N=C(CH ₃) ₂	F	H	H	CH ₃	H	Öl
I-213	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	(CH ₂) ₂ -	Cl	-O-N=C(CH ₃) ₂	F	H	H	CH ₃	H	Öl

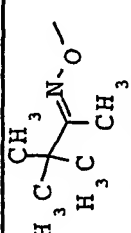
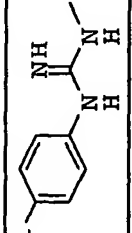
Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	phys. Daten (Fp. [°C])
I-214	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl		F	H	H	CH ₃	H	Öl
I-215	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		Cl	-O-N=CH(2,6-Cl ₂ -C ₆ H ₃)	F	H	H	CH ₃	H	148
I-216	-CH ₂ SC ₂ H ₄ CH ₂ -		Cl	-S-CH ₃	F	H	H	H	H	Öl
I-217	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Cl	-S-CH ₃	F	H	H	H	H	Öl
I-218	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	Cl	-CH ₃	H	H	F	H	H	75-77
I-219	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-O-N=C(CH ₃)CF ₃	F	F	H	F	H	205-207
I-220	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-NH-N=C(CH ₃)-C ₆ H ₅	F	F	H	F	H	185-187
I-221	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-NH-N=C(CF ₃)-C ₆ H ₅	F	F	H	F	H	84-87
I-222	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-NH-N=CH-C ₆ H ₅	F	F	H	F	H	138-140
I-223	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-O-CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-224	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-O-CH ₃	F	F	H	F	H	137-139
I-225	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-O-CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-226	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-227	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-228	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-CH ₃	F	F	H	F	H	112-116
I-229	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-CH(CH ₃) ₂	F	F	H	F	H	Öl
I-230	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	95-98
I-231	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-N(CH ₃) ₂	Cl	F	H	H	H	91-94
I-232	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-NHOCH ₃	Cl	F	H	H	H	151-153

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	phys. Daten (Fp. [°C])
I-233	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-NH-C ₆ H ₅	Cl	F	H	H	H	Öl
I-234	CH(CH ₃) ₂	H	Cl		Cl	F	H	H	H	Öl
I-235	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-O-CH ₃	Cl	F	H	H	H	147-149
I-236	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-O-CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	H	H	165-168
I-237	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-O-CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	H	H	110-112
I-238	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-O-CH(CH ₃) ₂	Cl	F	H	H	H	125-127
I-239	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-O-C(CH ₃) ₃	Cl	F	H	H	H	118-121
I-240	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-O-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	H	H	98-100
I-241	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-O-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	H	H	108-111
I-242	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-CH ₃	Cl	F	H	H	H	106-110
I-243	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	H	H	Öl
I-244	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-CH(CH ₃) ₂	Cl	F	H	H	H	111-113
I-245	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-C(CH ₃) ₃	Cl	F	H	H	H	94-96
I-246	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	H	H	Öl
I-247	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	H	H	114-117
I-248	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-CH ₂ CH ₃	Cl	F	H	H	H	104-108
I-249	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-CN	Cl	F	H	H	H	186-188
I-250	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	-S-CH ₃	F	H	H	H	H	Öl

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	phys. Daten (Fp. [°C])
I-251	CH ₂ CH=CH ₂	H	Cl	-S-CH ₃	F	H	H	H	H	124-126
I-252	CH ₂ -C ₆ H ₅	H	Cl	-S-CH ₃	F	H	H	H	H	135-137
I-253	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-O-N=CHCH ₃	F	F	H	F	H	139-141
I-254	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-O-N=C(CH ₃) ₂	F	F	H	F	H	157-159
I-255	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl		F	F	H	F	H	88-92
I-256	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl		F	F	H	F	H	176-179
I-257	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-ON=C(CH ₃)-OCH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	110-112
I-258	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl		F	F	H	F	H	350
I-259	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl		F	F	H	F	H	68-70
I-260	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-ON=CH-C ₆ H ₅	F	F	H	F	H	145-146
I-261	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-ON=C(CH ₃)C ₆ H ₅	F	F	H	F	H	151-155
I-262	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-O-N=CH(2,6-Cl ₂ -C ₆ H ₃)	F	F	H	F	H	87-90

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	phys. Daten (Fp. [°C])
I-263	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl		F	F	H	F	H	84-86
I-264	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-265	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-N(CH ₃)-N=C(CH ₃)-C ₆ H ₅	F	F	H	F	H	Öl
I-266	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-N(CH ₃)-N=CH-C ₆ H ₅	F	F	H	F	H	152-155
I-267	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-N(CH ₃)-N=C(CH ₃) ₂	F	F	H	F	H	205-208
I-268	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-NH-C(=NH)CH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-269	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-NH-NH-C ₆ H ₅	F	F	H	F	H	Öl
I-270	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl		F	F	H	F	H	132-134
I-271	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-N(CH ₃)-NH ₂	F	F	H	F	H	126-128
I-272	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-NH-NH-CH ₂ CF ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-273	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-N ₃	F	F	H	F	H	152-154
I-274	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-OH	F	F	H	F	H	137-146
I-275	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-O-CH ₃	F	F	H	F	H	121-129
I-276	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-O-CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	147-149

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	phys. Daten (Fp. [°C])
I-277	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-O-CH(CH ₃) ₂	F	F	H	F	H	159-161
I-278	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-O-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	116-117
I-279	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-O-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	129-131
I-280	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-S-CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-281	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-S-CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	68-69
I-282	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-S-CH(CH ₃) ₂	F	F	H	F	H	73-76
I-283	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-S-C(CH ₃) ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-284	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-S-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	Öl
I-285	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-S-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	64-65
I-286	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-CH ₃	F	F	H	F	H	83-85
I-287	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-CN	F	F	H	F	H	134-136
I-288	(S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-CH ₃	Cl	F	H	H	H	87-90
I-289	(R/S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-O-N=C(CH ₃) ₂	F	F	H	F	H	82
I-290	(R/S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl		F	F	H	F	H	130
I-291	(R/S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl		F	F	H	F	H	69
I-292	(R/S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-ON=C(CH ₃)-OCH ₂ CH ₃	F	F	H	F	H	120
I-293	(R/S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl		F	F	H	F	H	87

Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	phys. Daten (Fp. [°C])
I-294	(R/S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl		F	F	H	F	H	97
I-295	(R/S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-ON=CH-C ₆ H ₅	F	F	H	F	H	140
I-296	(R/S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-ON=C(CH ₃)-C ₆ H ₅	F	F	H	F	H	175
I-297	(R/S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-ON=CH-(2,6-Cl ₂ -C ₆ H ₃)	F	F	H	F	H	157
I-298	(R/S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl		F	F	H	F	H	Öl
I-299	(R/S)-CH(CF ₃)CH ₃	H	Cl	-N(CH ₃) ₂	F	F	H	F	H	108-112

Die R⁴-Gruppen sind über die freien Valenzen an den Pyrimidin-Grundkörper gebunden.

Die Gruppen R⁴ können aufgrund ihrer C=C-, C=N- und N=N-Doppelbindungen als E/Z-Isomerengemische vorliegen.

Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der Formel I ließ sich
5 durch die folgenden Versuche zeigen:

Die Wirkstoffe wurden getrennt oder gemeinsam als 10%ige Emulsion
in einem Gemisch aus 70 Gew.-% Cyclohexanon, 20 Gew.-% Nekanil®
LN (Lutensol® AP6, Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung
10 auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) und 10 Gew.-% Wettol®
EM (nichtionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Ri-
cinusöl) aufbereitet und entsprechend der gewünschten Konzentra-
tion mit Wasser verdünnt.

15 Anwendungsbeispiel 1 - Wirksamkeit gegen die Septoria-Blattflek-
kenkrankheit des Weizens (*Septoria tritici*)

Blätter von in Töpfen gewachsenen Weizenkeimlingen der Sorte "Ri-
band" wurden mit wäßriger Wirkstoffaufbereitung, die aus einer
20 Stammlösung bestehend aus 10 % Wirkstoff, 85 % Cyclohexanon und
5 % Emulgiermittel angesetzt wurde, bis zur Tropfnässe besprüht.
24 Stunden nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden sie mit
einer wässrigen Sporensuspension von *Septoria tritici* inokuliert.
Die Suspension enthielt 2.0×10^6 Sporen/ml. Die Versuchspflanzen
25 wurden anschließend im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 18
und 22°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit nahe 100 % aufge-
stellt. Nach 2 Wochen wurde das Ausmaß der Krankheitsentwicklung
visuell in % Befall der gesamten Blattfläche ermittelt.

30 In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe Nr. 1, 12
bis 15, 18, 19, 21, 24 bis 26, 30, 32, 33, 54, 55, 60, 61 bis 65,
86, 160, 223, 224, 226, 228, 235 bis 239, 248, 254, 264, 265,
269, 270, 271, 272 und 275 bis 278 der Tabelle I behandelten
Pflanzen maximal 7 % Befall, während die unbehandelten Pflanzen
35 zu 90 % befallen waren.

Anwendungsbeispiel 2 - Wirksamkeit gegen die Netzfleckenkrankheit
der Gerste (*Pyrenophora teres*)

40 Blätter von in Töpfen gewachsenen Gerstenkeimlingen der Sorte
"Igri" wurden mit wäßriger Wirkstoffaufbereitung, die aus einer
Stammlösung bestehend aus 10 % Wirkstoff, 85 % Cyclohexanon und
5 % Emulgiermittel angesetzt wurde, bis zur Tropfnässe besprüht
und 24 Stunden nach dem Antrocknen des Spritzbelages mit einer
45 wässrigen Sporensuspension von *Pyrenophora* [syn. *Drechslera*] *te-*
res, dem Erreger der Netzfleckenkrankheit, inokuliert. Anschlie-
ßend wurden die Versuchspflanzen im Gewächshaus bei Temperaturen

52

zwischen 20 und 24°C und 95 bis 100 % relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt. Nach 6 Tagen wurde das Ausmaß der Krankheitsentwicklung visuell in % Befall der gesamten Blattfläche ermittelt.

5 In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe Nr. 1, 55, 60, 64, 73, 88, 130, 134, 160, 163, 165, 168, 171, 185, 186, 254, 255, 265, 267, 271, 274, 276, 277, 278 und 287 der Tabelle I behandelten Pflanzen nicht über 15 % Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 100 % befallen waren.

10

Anwendungsbeispiel 3 - Protektive Wirksamkeit gegen den durch *Sphaerotheca fuliginea* verursachten Gurkenmehltau

Blätter von in Töpfen gewachsenen Gurkenkeimlingen der Sorte
15 "Chinesische Schlange" wurden im Keimblattstadium mit wässriger Wirkstoffaufbereitung, die aus einer Stammlösung bestehend aus 10 % Wirkstoff, 85 % Cyclohexanon und 5 % Emulgiermittel ange-
setzt wurde, bis zur Tropfnässe besprüht. 20 Stunden nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die Pflanzen mit einer wässri-
20 gen Sporensuspension des Gurkenmehltaus (*Sphaerotheca fuliginea*) inokuliert. Anschließend wurden die Pflanzen im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 24°C und 60 bis 80 % relativer Luft-
feuchtigkeit für 7 Tage kultiviert. Dann wurde das Ausmaß der
Mehltauentwicklung visuell in %-Befall der Keimblattfläche ermit-
25 telt.

In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe Nr. 86, 88, 100, 121, 130, 141, 160, 163, 168, 171, 185, 186, 189, 206, 220, 249, 253 bis 261, 265, 266, 271, 273, 275, 276, 287 und 299 der
30 Tabelle I behandelten Pflanzen nicht über 10 % Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 85 % befallen waren.

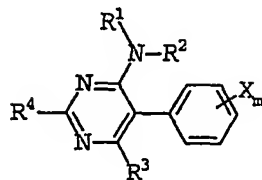
35

40

45

Patentansprüche:

1. 5-Phenylpyrimidine der Formel I



I

in der die Substituenten und der Index folgende Bedeutung haben:

R^1, R^2 unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_3 - C_6 -Halogenacycloalkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Halogenalkenyl, C_2 - C_6 -Alkynyl oder C_2 - C_6 -Halogenalkynyl,

R^1 und R^2 können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch eine Ether-(-O-), Thio-(-S-), Sulfoxyl-(-S[=O]-) oder Sulfenyl-(-SO₂-) Gruppe unterbrochen sein und durch eine bis vier Gruppen R^a und/oder R^b substituiert sein kann;

R^a, R^b unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_2 - C_8 -Alkenyl, C_2 - C_8 -Alkynyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy,

C_3 - C_{10} -Cycloalkyl, Phenyl oder fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, wobei die cyclischen Reste teilweise oder vollständig substituiert sein können durch folgende Gruppen R^x :

R^x unabhängig voneinander Cyano, Nitro, Amino, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Halogen, Hydroxy, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Alkylcarbonyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfoxyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, C_1 - C_6 -Alkyl-oxycarbonyl, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_6 -Alkylamino, Di- C_1 - C_6 -Alkylamino, C_1 - C_6 -Alkylaminocarbonyl, Di- C_1 - C_6 -Alkylaminocarbonyl, C_1 - C_6 -Alkylamino-

54

thiocarbonyl, Di-C₁-C₆-Alkylaminothiocarbonyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, Phenyl, Phenoxy, Benzyl, Benzyloxy, 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl, 5- oder 6-gliedriges Hetaryl, 5- oder 6-gliedriges Hetaryloxy, C(=NOR^α)-OR^β oder OC(R^α)₂-C(R^β)=NOR^β,

wobei die cyclischen Gruppen ihrerseits unsubstituiert oder substituiert sind durch einen bis drei Reste R^γ:

R^γ Cyano, Nitro, Halogen, Hydroxy, Amino, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Alkylsulfoxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, Di-C₁-C₆-alkylamino, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, Di-C₁-C₆-alkylaminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylaminothiocarbonyl, Di-C₁-C₆-alkylaminothiocarbonyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkenyl, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Benzyl, Benzyloxy, 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl, 5- oder 6-gliedriges Hetaryl, 5- oder 6-gliedriges Hetaryloxy oder C(=NOR^α)-OR^β;

R^α, R^β Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;

R^a und R^b können auch gemeinsam über eine Alkylen- oder Alkenylenkette mit dem überbrückenden Atom einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden;

R^c eine der bei R^a und R^b genannten monovalenten Gruppen;

R³ Wasserstoff, Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy oder C₃-C₈-Alkenyloxy;

R⁴ Wasserstoff, Halogen, Cyano, Hydroxy, Mercapto, Azido, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkinyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₃-C₈-Alkenyloxy, C₃-C₈-Alkinyloxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₃-C₈-Alkenylthio, C₃-C₈-Alkinylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio,

55

-ON=CR^aR^b, -CR^c=NOR^a, -NR^cN=CR^aR^b, -NR^aR^b, -NR^cNR^aR^b,
 -NOR^a, -NR^cC(=NR^{c'})NR^aR^b, -NR^cC(=O)NR^aR^b, -NR^aC(=O)R^c,
 -NR^aC(=NOR^c)R^{c'}, -OC(=O)R^c, -C(=NOR^c)NR^aR^b,
 -CR^c(=NNR^aR^b), -C(=O)NR^aR^b oder -C(=O)R^c;

5

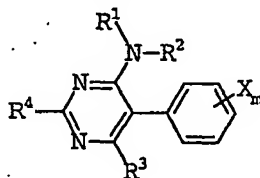
X Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy oder C₁-C₆-Halogenalkyl; und

m eine ganze Zahl von 1 bis 5.

10

2. 5-Phenylpyrimidine der Formel I gemäß Anspruch 1,

15



I

in der die Substituenten und der Index folgende Bedeutung haben:

20

R¹, R² unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Halogenacycloalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Alkynyl oder C₂-C₆-Halogenalkynyl,

25

R¹ und R² können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch ein Sauerstoffatom unterbrochen sein und einen C₁-C₆-Alkylsubstituenten tragen kann oder in dem zwei benachbarte Kohlenstoffringglieder durch eine C₁-C₄-Alkylengruppe verbrückt sein können;

30

R³ Wasserstoff, Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy oder C₃-C₈-Alkenyloxy;

35

R⁴ Wasserstoff, Halogen, Cyano, Hydroxy, Mercapto, Azido, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₃-C₈-Alkenyloxy, C₃-C₈-Alkynyloxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₃-C₈-Alkenylthio, C₃-C₈-Alkynylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, -ON=CR^aR^b, -CR^a=NOR^b, -NR^aN=CR^aR^b, NR^aR^b, -NR^aNR^aR^b oder -NOR^a;

40

45

56

R^a, R^b unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_2 - C_8 -Alkenyl, C_2 - C_8 -Alkinyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy,

5 C_3 - C_{10} -Cycloalkyl, Phenyl oder fünf- bis zehngliederiger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, wobei die cyclischen Reste teilweise oder vollständig substituiert sein können durch folgende Gruppen R^x :

15 R^x unabhängig voneinander Cyano, Nitro, Amino, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Halogen, Hydroxy, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Alkylcarbonyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfoxyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, C_1 - C_6 -Alkyl-oxycarbonyl, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_6 -Alkylamino, 20 Di- C_1 - C_6 -Alkylamino, C_1 - C_6 -Alkylaminocarbonyl, Di- C_1 - C_6 -Alkylaminocarbonyl, C_1 - C_6 -Alkylaminothiocarbonyl, Di- C_1 - C_6 -Alkylaminothiocarbonyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkenyloxy, Phenyl, Phenoxy, Benzyl, Benzyl-oxo, 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl, 5- oder 6-gliedriges Hetaryl, 25 5- oder 6-gliedriges Hetaryloxy, $C(=NOR^a)-OR^b$ oder $OC(R^a)_2-C(R^b)=NOR^b$,

30 wobei die cyclischen Gruppen ihrerseits unsubstituiert oder substituiert sind durch einen bis drei Reste R^y :

35 R^y Cyano, Nitro, Halogen, Hydroxy, Amino, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfoxyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, C_1 - C_6 -Alkoxy-oxycarbonyl, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_6 -Alkylamino, Di- C_1 - C_6 -alkylamino, C_1 - C_6 -Alkylaminocarbonyl, 40 Di- C_1 - C_6 -alkylaminocarbonyl, C_1 - C_6 -Alkylaminothiocarbonyl, Di- C_1 - C_6 -alkylaminothiocarbonyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkenyloxy, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkenyl, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Benzyl, Benzyl-oxo, 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl, 45

57

5- oder 6-gliedriges Hetaryl, 5- oder
6-gliedriges Hetaryloxy oder $C(=NOR^a)-OR^b$;

R^a, R^b Wasserstoff oder C_1-C_6 -Alkyl;

5

X Halogen, C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_6 -Alkoxy oder C_1-C_6 -Halogenalkyl; und

m eine ganze Zahl von 1 bis 5.

10

3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der

R^4 Wasserstoff, Cyano, Azido, C_1-C_6 -Alkyl, C_2-C_8 -Alkenyl,
 C_2-C_8 -Alkinyl, C_1-C_6 -Halogenalkyl, $-CR^c=NOR^c$, $-ON=CR^aR^b$
oder $-NR^cN=CR^aR^b$ oder $-C(=NOR^c)NR^aR^b$, bedeutet.

15

4. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der R^4 für
 $-ON=CR^aR^b$ steht.

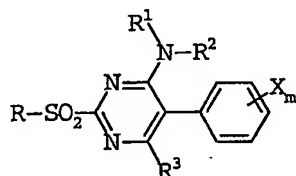
20

5. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der R^4 für
 $-CR^c=NOR^a$ steht.

25

6. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel gemäß
Anspruch 1, in der R^4 für Cyano oder eine über ein Heteroatom
gebundene Gruppe steht, durch Umsetzung von Sulfonen der Formel II,

30



II

in der R für C_1-C_4 -Alkyl steht, mit Verbindungen der Formel
III,

35

 R^4-H

III

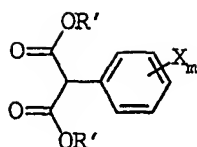
in der R^4 die vorstehend gegebene Bedeutung hat, unter basischen Bedingungen.

40

7. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel gemäß
Anspruch 1, in der R^3 für Halogen und R^4 für Wasserstoff, Alkyl,
Alkenyl, Alkinyl oder Halogenalkyl steht, durch Umsetzung
von Phenylmalonestern der Formel IV

45

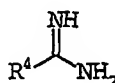
58



IV

5

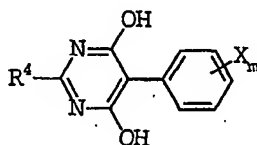
mit Amidinen der Formel V,



V

10

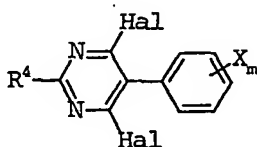
in der R⁴ die vorstehend genannte Bedeutung hat, und Halogenierung der entstandenen Dihydroxypyrimidine VI



VI

15

mit Halogenierungsmitteln zu Dihalogenpyrimidinen VII,

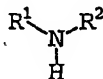


VII

20

in der Hal für Brom oder Chlor steht, die mit Aminen der Formel VIII,

25



VIII

in der R¹ und R² die für Formel I gegebene Bedeutung haben, zu Verbindungen der Formel I umgesetzt werden.

30

8. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel gemäß Anspruch 1, in der R³ für Cyano, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy oder C₃-C₈-Alkenyloxy steht, durch Umsetzung von Pyrimidinen der Formel I, in der R³ für Halogen steht, mit Verbindungen der Formel IX

35

R³-H

IX

in der R³ die vorstehend genannte Bedeutung hat, unter basischen Bedingungen.

40

9. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel gemäß Anspruch 1, in der R³ für C₁-C₆-Alkyl steht, durch Umsetzung von Pyrimidinen der Formel I, in der R³ für Halogen steht, mit metallorganischen Verbindungen der Formel X

45

R³-M

X

5 in der M für eine Gruppe Mg-Hal, Zn-R³ oder B(OR)₂ steht, wobei bei Hal ein Halogenatom und R Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl bedeutet und R³ für C₁-C₆-Alkyl steht.

10. Fungizides Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel I gemäß den Ansprüchen 1 bis 5.

11. Verfahren zur Bekämpfung von phytopathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß den Ansprüchen 1 bis 5 behandelt.

20

25

30

35

40

45

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP 02/12807

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 C07D239/46 C07D239/48 C07D239/42 C07D239/52 C07D403/12
A01N43/54

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

CHEM ABS Data, EPO-Internal, PAJ

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 0 727 214 A (WELLCOME) 21 August 1996 (1996-08-21) the whole document	1,2
X	WO 99 19305 A (KRENITSKY PHARMA.) 22 April 1999 (1999-04-22) page 67, line 33 -page 71; claim 1	1,2
X	US 5 597 827 A (ALISTAIR A. MILLER) 28 January 1997 (1997-01-28) claims; examples	1,2
X	US 5 591 746 A (ALISTAIR A. MILLER) 7 January 1997 (1997-01-07) claims; examples	1,2

	--- -/--	

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- *G* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

6 February 2003

Date of mailing of the international search report

24/02/2003

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Francois, J

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP 02/12807

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 125, no. 17, 1996 Columbus, Ohio, US; abstract no. 221864m, page 1109; column 1; XP002230224 abstract; figure I & PL 169 025 A (POLITECHNIKA SLASKA) 31 May 1996 (1996-05-31) ----	1,10
A	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 114, no. 5, 1991 Columbus, Ohio, US; abstract no. 57530z, page 247; column 1; XP002230225 abstract & JP 02 200678 A (KUMIAI) 8 August 1990 (1990-08-08) ----	1,10
P,X	WO 02 74753 A (BASF) 26 September 2002 (2002-09-26) claims; figures I,VIII ----	1,2,10, 11
P,X	WO 01 96314 A (BASF) 20 December 2001 (2001-12-20) claims; figure VIII -----	1,2,10, 11

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 02/12807

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 727214	A	21-08-1996	EP 0727212 A2	21-08-1996
			EP 0727213 A2	21-08-1996
			EP 0727214 A2	21-08-1996
			EP 0713703 A2	29-05-1996
			EP 0715851 A2	12-06-1996
			AP 164 A	12-01-1992
			AT 144422 T	15-11-1996
			AU 639216 B2	22-07-1993
			AU 4596489 A	14-06-1990
			AU 4915493 A	13-01-1994
			AU 5195296 A	18-07-1996
			AU 5195396 A	04-07-1996
			AU 690443 B2	23-04-1998
			AU 5195596 A	04-07-1996
			AU 5195696 A	04-07-1996
			CA 2004747 A1	07-06-1990
			CN 1052306 A	19-06-1991
			CN 1119099 A	27-03-1996
			CN 1115756 A ,B	31-01-1996
			CN 1113487 A ,B	20-12-1995
			CN 1117046 A	21-02-1996
			DD 292250 A5	25-07-1991
			DE 68927368 D1	28-11-1996
			DK 90399 A	24-06-1999
			DK 613289 A	08-06-1990
			EP 0372934 A2	13-06-1990
			ES 2095842 T3	01-03-1997
			FI 955939 A	11-12-1995
			FI 955940 A	11-12-1995
			FI 955941 A	11-12-1995
			GR 3022031 T3	31-03-1997
			HK 1004092 A1	13-11-1998
			HU 55764 A2	28-06-1991
			HU 9500740 A3	28-11-1995
			HU 9500754 A3	28-11-1995
			IE 80711 B1	16-12-1998
			IL 92558 A	31-01-1996
			IL 111627 A	10-06-1997
			IL 114335 A	06-12-2000
			JP 2202876 A	10-08-1990
			JP 2795498 B2	10-09-1998
			KR 145308 B1	15-07-1998
			LT 269 A ,B	25-10-1994
			LV 10442 A ,B	20-02-1995
			MC 2076 A	12-10-1990
			MX 9203422 A1	01-07-1992
WO 9919305	A	22-04-1999	AU 9693998 A	03-05-1999
			CA 2305255 A1	22-04-1999
			EP 1025091 A1	09-08-2000
			JP 2001519416 T	23-10-2001
			WO 9919305 A2	22-04-1999
			US 6440965 B1	27-08-2002
US 5597827	A	28-01-1997	AP 164 A	12-01-1992
			AT 144422 T	15-11-1996
			AU 639216 B2	22-07-1993
			AU 4596489 A	14-06-1990

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 02/12807

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 5597827	A		AU 4915493 A	13-01-1994
			AU 5195296 A	18-07-1996
			AU 5195396 A	04-07-1996
			AU 690443 B2	23-04-1998
			AU 5195596 A	04-07-1996
			AU 5195696 A	04-07-1996
			CA 2004747 A1	07-06-1990
			CN 1052306 A	19-06-1991
			CN 1119099 A	27-03-1996
			CN 1115756 A ,B	31-01-1996
			CN 1113487 A ,B	20-12-1995
			CN 1117046 A	21-02-1996
			DD 292250 A5	25-07-1991
			DE 68927368 D1	28-11-1996
			DK 90399 A	24-06-1999
			DK 613289 A	08-06-1990
			EP 0372934 A2	13-06-1990
			EP 0727212 A2	21-08-1996
			EP 0727213 A2	21-08-1996
			EP 0727214 A2	21-08-1996
			EP 0713703 A2	29-05-1996
			EP 0715851 A2	12-06-1996
			ES 2095842 T3	01-03-1997
			FI 955939 A	11-12-1995
			FI 955940 A	11-12-1995
			FI 955941 A	11-12-1995
			GR 3022031 T3	31-03-1997
			HK 1004092 A1	13-11-1998
			HU 55764 A2	28-06-1991
			HU 9500740 A3	28-11-1995
			HU 9500754 A3	28-11-1995
			IE 80711 B1	16-12-1998
			IL 92558 A	31-01-1996
			IL 111627 A	10-06-1997
			IL 114335 A	06-12-2000
			JP 2202876 A	10-08-1990
			JP 2795498 B2	10-09-1998
			KR 145308 B1	15-07-1998
			LT 269 A ,B	25-10-1994
			LV 10442 A ,B	20-02-1995
			MC 2076 A	12-10-1990
US 5591746	A	07-01-1997	AP 164 A	12-01-1992
			AT 144422 T	15-11-1996
			AU 639216 B2	22-07-1993
			AU 4596489 A	14-06-1990
			AU 4915493 A	13-01-1994
			AU 5195296 A	18-07-1996
			AU 5195396 A	04-07-1996
			AU 690443 B2	23-04-1998
			AU 5195596 A	04-07-1996
			AU 5195696 A	04-07-1996
			CA 2004747 A1	07-06-1990
			CN 1052306 A	19-06-1991
			CN 1119099 A	27-03-1996
			CN 1115756 A ,B	31-01-1996
			CN 1113487 A ,B	20-12-1995
			CN 1117046 A	21-02-1996

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 02/12807

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 5591746	A		DD 292250 A5	25-07-1991
			DE 68927368 D1	28-11-1996
			DK 90399 A	24-06-1999
			DK 613289 A	08-06-1990
			EP 0372934 A2	13-06-1990
			EP 0727212 A2	21-08-1996
			EP 0727213 A2	21-08-1996
			EP 0727214 A2	21-08-1996
			EP 0713703 A2	29-05-1996
			EP 0715851 A2	12-06-1996
			ES 2095842 T3	01-03-1997
			FI 955939 A	11-12-1995
			FI 955940 A	11-12-1995
			FI 955941 A	11-12-1995
			GR 3022031 T3	31-03-1997
			HK 1004092 A1	13-11-1998
			HU 55764 A2	28-06-1991
			HU 9500740 A3	28-11-1995
			HU 9500754 A3	28-11-1995
			IE 80711 B1	16-12-1998
			IL 92558 A	31-01-1996
			IL 111627 A	10-06-1997
			IL 114335 A	06-12-2000
			JP 2202876 A	10-08-1990
			JP 2795498 B2	10-09-1998
			KR 145308 B1	15-07-1998
			LT 269 A ,B	25-10-1994
			LV 10442 A ,B	20-02-1995
			MC 2076 A	12-10-1990
PL 169025	A	30-05-1994	PL 296745 A1	30-05-1994
JP 02200678	A	08-08-1990	NONE	
WO 0274753	A	26-09-2002	WO 02074753 A2	26-09-2002
WO 0196314	A	20-12-2001	AU 7056401 A	24-12-2001
			WO 0196314 A1	20-12-2001

INTERNATIONALE RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 02/12807

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7 C07D239/46 C07D239/48 C07D239/42 C07D239/52 C07D403/12
A01N43/54

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

CHEM ABS Data, EPO-Internal, PAJ

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	EP 0 727 214 A (WELLCOME) 21. August 1996 (1996-08-21) das ganze Dokument ---	1,2
X	WO 99 19305 A (KRENITSKY PHARMA.) 22. April 1999 (1999-04-22) Seite 67, Zeile 33 -Seite 71; Anspruch 1 ---	1,2
X	US 5 597 827 A (ALISTAIR A. MILLER) 28. Januar 1997 (1997-01-28) Ansprüche; Beispiele ---	1,2
X	US 5 591 746 A (ALISTAIR A. MILLER) 7. Januar 1997 (1997-01-07) Ansprüche; Beispiele ---	1,2
	--- -/--	



Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen



Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

E älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

T Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderscher Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderscher Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

Z Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

6. Februar 2003

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

24/02/2003

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL- 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Francois, J

INTERNATIONALE RESEARCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 02/12807

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Beitr. Anspruch Nr.
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 125, no. 17, 1996 Columbus, Ohio, US; abstract no. 221864m, Seite 1109; Spalte 1; XP002230224 Zusammenfassung; Abbildung I & PL 169 025 A (POLITECHNIKA SLASKA) 31. Mai 1996 (1996-05-31) ---	1,10
A	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 114, no. 5, 1991 Columbus, Ohio, US; abstract no. 57530Z, Seite 247; Spalte 1; XP002230225 Zusammenfassung & JP 02 200678 A (KUMIAI) 8. August 1990 (1990-08-08) ---	1,10
P,X	WO 02 74753 A (BASF) 26. September 2002 (2002-09-26) Ansprüche; Abbildungen I,VIII ---	1,2,10, 11
P,X	WO 01 96314 A (BASF) 20. Dezember 2001 (2001-12-20) Ansprüche; Abbildung VIII -----	1,2,10, 11

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 02/12807

Im Recherchenbericht angeführtes Patentedokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 727214	A	21-08-1996	EP 0727212 A2	21-08-1996
			EP 0727213 A2	21-08-1996
			EP 0727214 A2	21-08-1996
			EP 0713703 A2	29-05-1996
			EP 0715851 A2	12-06-1996
			AP 164 A	12-01-1992
			AT 144422 T	15-11-1996
			AU 639216 B2	22-07-1993
			AU 4596489 A	14-06-1990
			AU 4915493 A	13-01-1994
			AU 5195296 A	18-07-1996
			AU 5195396 A	04-07-1996
			AU 690443 B2	23-04-1998
			AU 5195596 A	04-07-1996
			AU 5195696 A	04-07-1996
			CA 2004747 A1	07-06-1990
			CN 1052306 A	19-06-1991
			CN 1119099 A	27-03-1996
			CN 1115756 A ,B	31-01-1996
			CN 1113487 A ,B	20-12-1995
			CN 1117046 A	21-02-1996
			DD 292250 A5	25-07-1991
			DE 68927368 D1	28-11-1996
			DK 90399 A	24-06-1999
			DK 613289 A	08-06-1990
			EP 0372934 A2	13-06-1990
			ES 2095842 T3	01-03-1997
			FI 955939 A	11-12-1995
			FI 955940 A	11-12-1995
			FI 955941 A	11-12-1995
			GR 3022031 T3	31-03-1997
			HK 1004092 A1	13-11-1998
			HU 55764 A2	28-06-1991
			HU 9500740 A3	28-11-1995
			HU 9500754 A3	28-11-1995
			IE 80711 B1	16-12-1998
			IL 92558 A	31-01-1996
			IL 111627 A	10-06-1997
			IL 114335 A	06-12-2000
			JP 2202876 A	10-08-1990
			JP 2795498 B2	10-09-1998
			KR 145308 B1	15-07-1998
			LT 269 A ,B	25-10-1994
			LV 10442 A ,B	20-02-1995
			MC 2076 A	12-10-1990
			MX 9203422 A1	01-07-1992
WO 9919305	A	22-04-1999	AU 9693998 A	03-05-1999
			CA 2305255 A1	22-04-1999
			EP 1025091 A1	09-08-2000
			JP 2001519416 T	23-10-2001
			WO 9919305 A2	22-04-1999
			US 6440965 B1	27-08-2002
US 5597827	A	28-01-1997	AP 164 A	12-01-1992
			AT 144422 T	15-11-1996
			AU 639216 B2	22-07-1993
			AU 4596489 A	14-06-1990

INTERNATIONALER RESEARCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationaler Aktenzeichen

PCT/EP 02/12807

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
US 5597827 A		AU 4915493 A	13-01-1994
		AU 5195296 A	18-07-1996
		AU 5195396 A	04-07-1996
		AU 690443 B2	23-04-1998
		AU 5195596 A	04-07-1996
		AU 5195696 A	04-07-1996
		CA 2004747 A1	07-06-1990
		CN 1052306 A	19-06-1991
		CN 1119099 A	27-03-1996
		CN 1115756 A ,B	31-01-1996
		CN 1113487 A ,B	20-12-1995
		CN 1117046 A	21-02-1996
		DD 292250 A5	25-07-1991
		DE 68927368 D1	28-11-1996
		DK 90399 A	24-06-1999
		DK 613289 A	08-06-1990
		EP 0372934 A2	13-06-1990
		EP 0727212 A2	21-08-1996
		EP 0727213 A2	21-08-1996
		EP 0727214 A2	21-08-1996
		EP 0713703 A2	29-05-1996
		EP 0715851 A2	12-06-1996
		ES 2095842 T3	01-03-1997
		FI 955939 A	11-12-1995
		FI 955940 A	11-12-1995
		FI 955941 A	11-12-1995
		GR 3022031 T3	31-03-1997
		HK 1004092 A1	13-11-1998
		HU 55764 A2	28-06-1991
		HU 9500740 A3	28-11-1995
		HU 9500754 A3	28-11-1995
		IE 80711 B1	16-12-1998
		IL 92558 A	31-01-1996
		IL 111627 A	10-06-1997
		IL 114335 A	06-12-2000
		JP 2202876 A	10-08-1990
		JP 2795498 B2	10-09-1998
		KR 145308 B1	15-07-1998
		LT 269 A ,B	25-10-1994
		LV 10442 A ,B	20-02-1995
		MC 2076 A	12-10-1990
US 5591746 A	07-01-1997	AP 164 A	12-01-1992
		AT 144422 T	15-11-1996
		AU 639216 B2	22-07-1993
		AU 4596489 A	14-06-1990
		AU 4915493 A	13-01-1994
		AU 5195296 A	18-07-1996
		AU 5195396 A	04-07-1996
		AU 690443 B2	23-04-1998
		AU 5195596 A	04-07-1996
		AU 5195696 A	04-07-1996
		CA 2004747 A1	07-06-1990
		CN 1052306 A	19-06-1991
		CN 1119099 A	27-03-1996
		CN 1115756 A ,B	31-01-1996
		CN 1113487 A ,B	20-12-1995
		CN 1117046 A	21-02-1996

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 02/12807

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
US 5591746	A		DD 292250 A5	25-07-1991
			DE 68927368 D1	28-11-1996
			DK 90399 A	24-06-1999
			DK 613289 A	08-06-1990
			EP 0372934 A2	13-06-1990
			EP 0727212 A2	21-08-1996
			EP 0727213 A2	21-08-1996
			EP 0727214 A2	21-08-1996
			EP 0713703 A2	29-05-1996
			EP 0715851 A2	12-06-1996
			ES 2095842 T3	01-03-1997
			FI 955939 A	11-12-1995
			FI 955940 A	11-12-1995
			FI 955941 A	11-12-1995
			GR 3022031 T3	31-03-1997
			HK 1004092 A1	13-11-1998
			HU 55764 A2	28-06-1991
			HU 9500740 A3	28-11-1995
			HU 9500754 A3	28-11-1995
			IE 80711 B1	16-12-1998
			IL 92558 A	31-01-1996
			IL 111627 A	10-06-1997
			IL 114335 A	06-12-2000
			JP 2202876 A	10-08-1990
			JP 2795498 B2	10-09-1998
			KR 145308 B1	15-07-1998
			LT 269 A ,B	25-10-1994
			LV 10442 A ,B	20-02-1995
			MC 2076 A	12-10-1990
PL 169025	A	30-05-1994	PL 296745 A1	30-05-1994
JP 02200678	A	08-08-1990	KEINE	
WO 0274753	A	26-09-2002	WO 02074753 A2	26-09-2002
WO 0196314	A	20-12-2001	AU 7056401 A	24-12-2001
			WO 0196314 A1	20-12-2001